

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2005 年 8 月 25 日 (25.08.2005)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2005/077934 A1(51) 国際特許分類⁷: C07D 401/04, A01N 43/56, A61K 31/4439, A61P 33/02, 33/06, 33/10, 33/12, 33/14

(21) 国際出願番号: PCT/JP2005/002351

(22) 国際出願日: 2005 年 2 月 16 日 (16.02.2005)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:

特願2004-041295	2004 年 2 月 18 日 (18.02.2004)	JP
特願2004-133722	2004 年 4 月 28 日 (28.04.2004)	JP
特願2004-261507	2004 年 9 月 8 日 (08.09.2004)	JP
特願2004-295778	2004 年 10 月 8 日 (08.10.2004)	JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 石原産業株式会社 (ISHIHARA SANGYO KAISHA, LTD.) [JP/JP]; 〒5500002 大阪府大阪市西区江戸堀一丁目 3 番 1 5 号 Osaka (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 小柳 徹 (KOY-ANAGI, Toru) [JP/JP]; 〒5250025 滋賀県草津市西渋川二丁目 3 番 1 号 石原産業株式会社 中央研究所内 Shiga (JP). 森田 雅之 (MORITA, Masayuki) [JP/JP]; 〒5250025 滋賀県草津市西渋川二丁目 3 番 1 号 石原産業株式会社 中央研究所内 Shiga (JP). 中元 健一 (NAKAMOTO, Kenichi) [JP/JP]; 〒5250025 滋賀県草津市西渋川二丁目 3 番 1 号 石原産業株式会社 中

央研究所内 Shiga (JP). 久松 彰弘 (HISAMATSU, Akihiro) [JP/JP]; 〒5250025 滋賀県草津市西渋川二丁目 3 番 1 号 石原産業株式会社 中央研究所内 Shiga (JP).

(74) 代理人: 泉名 謙治, 外 (SENMYO, Kenji et al.); 〒1010042 東京都千代田区神田東松下町 3 8 番地 鳥本鋼業ビル Tokyo (JP).

(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

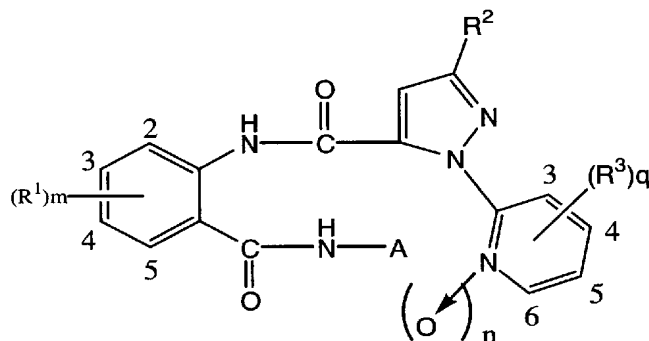
添付公開書類:

— 国際調査報告書

2 文字コード及び他の略語については、定期発行される各 PCT ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: ANTHRANILAMIDES, PROCESS FOR THE PRODUCTION THEREOF, AND PEST CONTROLLERS CONTAINING THE SAME

(54) 発明の名称: アントラニルアミド系化合物、それらの製造方法及びそれらを含む有害生物防除剤



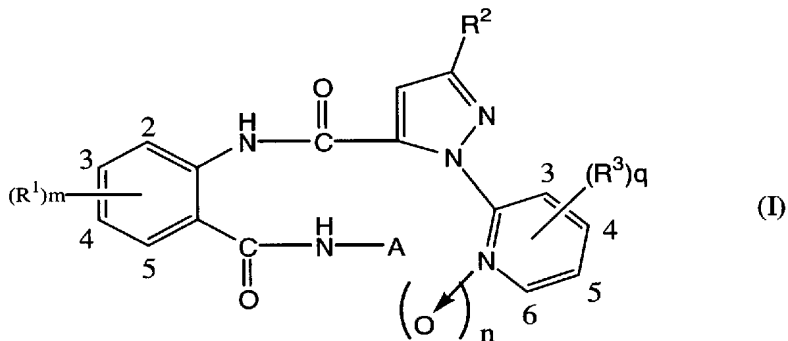
is 0 to 4.

(I)

(57) Abstract: The invention provides novel anthranilamides useful as pest controllers, salts of the same, a process for the production thereof, and pest controllers containing these compounds as the active ingredient. Anthranilamides represented by the general formula (I) or salts thereof: (I) wherein R¹ is halogeno, alkyl, haloalkyl, or the like; R² and R³ are each independently halogeno, alkyl, haloalkyl, or the like; A is alkyl substituted with Y; Y is C₃₋₄ cycloalkyl which may be substituted with at least one member selected from the group consisting of halogeno, alkyl, and haloalkyl; m is 0 to 4; n is 0 or 1; and q

[続葉有]

WO 2005/077934 A1



明 細 書

アントラニルアミド系化合物、それらの製造方法及びそれらを含む有害生物防除剤

技術分野

[0001] 特許文献1、特許文献2、特許文献3及び特許文献4には、それぞれ一定の化学構造を有するアントラニルアミド系化合物が開示されている。しかしながら、これらの特許文献中には、後記する本発明の式(I)中のAに相当する置換基としてC3-4シクロアルキルで置換されたアルキルを有する化合物はどこにも記載されていない。

また、特許文献5には、ベンゼン環の4位にシアノ基を有するアントラニルアミド系化合物が開示されている。しかし、後記する本発明の式(I)中のR¹の定義にはシアノ基が含まれず、両者の化学構造は異なる。

[0002] 特許文献1: 国際公開公報 WO03/24222号
特許文献2: 国際公開公報 WO03/15518号
特許文献3: 国際公開公報 WO03/15519号
特許文献4: 国際公開公報 WO01/70671号
特許文献5: 国際公開公報 WO04/67528号

発明の開示

発明が解決しようとする課題

[0003] 長年にわたり、多数の有害生物防除剤が使用されているが、効力が不十分、有害生物が抵抗性を獲得しその使用が制限される等、種々の課題を有するものが少なくない。

本発明は、かかる欠点の少ない新規な有害生物防除剤、例えば、農園芸分野で問題となる各種有害生物や、動物に寄生する有害生物を防除できる有害生物防除剤の開発が望まれている。

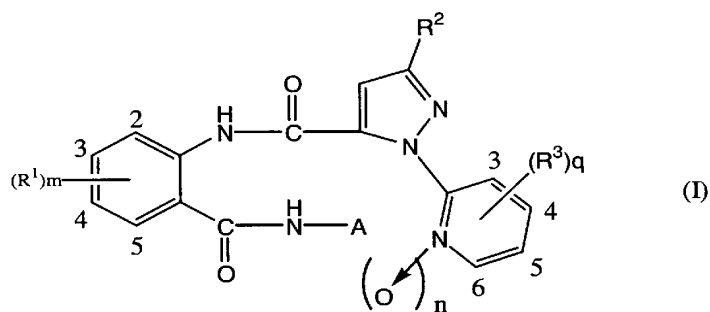
課題を解決するための手段

[0004] 本発明者らは、より優れた有害生物防除剤を見出すべくアントラニルアミド系化合物につき種々検討した。その結果、新規なアントラニルアミド系化合物又はその塩が

、低薬量で有害生物に対して極めて高い防除効果を有することを見出し、本発明を完成した。

すなわち、本発明は、式 (I)：

[0005] [化1]



[0006] (式中、R¹はハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルケニル、ハロアルケニル、アルキニル、ハロアルキニル、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルキルカルボニル、ハロアルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、ハロアルコキシカルボニル、置換されてもよいフェノキシカルボニル、ニトロ又はホルミルであり；R²及びR³は各々独立してハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ又はシアノであり；AはYで置換されたアルキルであり；Yはハロゲン、アルキル及びハロアルキルよりなる群から選ばれる少なくとも1つの置換基で置換されてもよいC3-4シクロアルキルであり；mは0-4であり；nは0又は1であり；qは0-4である。但しR¹がベンゼン環2位に置換したフッ素原子、塩素原子、臭素原子又はメチルであり、且つ別のR¹がベンゼン環4位に置換したハロゲンであるとき、その4位のハロゲンはフッ素原子又は塩素原子である)で表されるアントラニルアミド系化合物又はその塩、それらの製造方法並びにそれらを含む有害生物防除剤などに関する。

発明の効果

[0007] 前記式 (I) の新規アントラニルアミド系化合物を有効成分とする有害生物防除剤は、低薬量で有害生物に対して極めて高い防除効果を有する。

発明を実施するための最良の形態

[0008] R¹中の置換されてもよいフェノキシカルボニルの置換基としては、例えばハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、ハロアルキル

チオ、アルキルスルフィニル、ハロアルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ハロアルキルスルホニル、シアノ、ニトロなどが挙げられる。これら置換基の置換数は、1又は2以上であってよく、2以上の場合、各置換基は同一でも相異なってもよい。また、各置換基の置換位置はいずれの位置でもよい。

A中の置換基Yの置換数は、1又は2以上であってよく、2以上の場合、各置換基Yは同一でも相異なってもよい。また、置換基Yの置換位置はいずれの位置でもよい。A中の置換基Yの置換数は、望ましくは1である。

Y中のC3-4シクロアルキルの置換基であるハロゲン、アルキル又はハロアルキルの置換数は、1又は2以上であってよく、2以上の場合、各置換基は同一でも相異なってもよい。また、各置換基の置換位置はいずれの位置でもよい。Y中のC3-4シクロアルキルは、望ましくは無置換であるか、或は前述の置換基を有する場合、その置換数は1-5が望ましい。

R^1 、 R^2 、 R^3 又はY中のハロゲン又は置換基としてのハロゲンとしては、フッ素、塩素、臭素又はヨウ素の各原子が挙げられる。置換基としてのハロゲンの数は1又は2以上であってよく、2以上の場合、各ハロゲンは同一でも相異なってもよい。また、ハロゲンの置換位置はいずれの位置でもよい。

[0009] R^1 、 R^2 、 R^3 、A又はY中のアルキル又はアルキル部分は、直鎖又は分枝状のいずれでもよい。その具体例としては、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、ターシャリーブチル、ペンチル、ヘキシルのようなC1-6のものなどが挙げられる。

R^1 中のアルケニル又はアルケニル部分は、直鎖又は分枝状のいずれでもよい。その具体例としては、ビニル、1-プロペニル、アリル、イソプロペニル、1-ブテニル、1,3-ブタジエニル、1-ヘキセニルのようなC2-6のものなどが挙げられる。

R^1 中のアルキニル又はアルキニル部分は、直鎖又は分枝状のいずれでもよい。その具体例としては、エチニル、2-ブチニル、2-ペンチニル、3-ヘキシニルのようなC2-6のものなどが挙げられる。

Y中のC3-4シクロアルキル又はシクロアルキル部分の具体例としては、シクロプロピル又はシクロブチルが挙げられ、中でもシクロプロピルが望ましい。

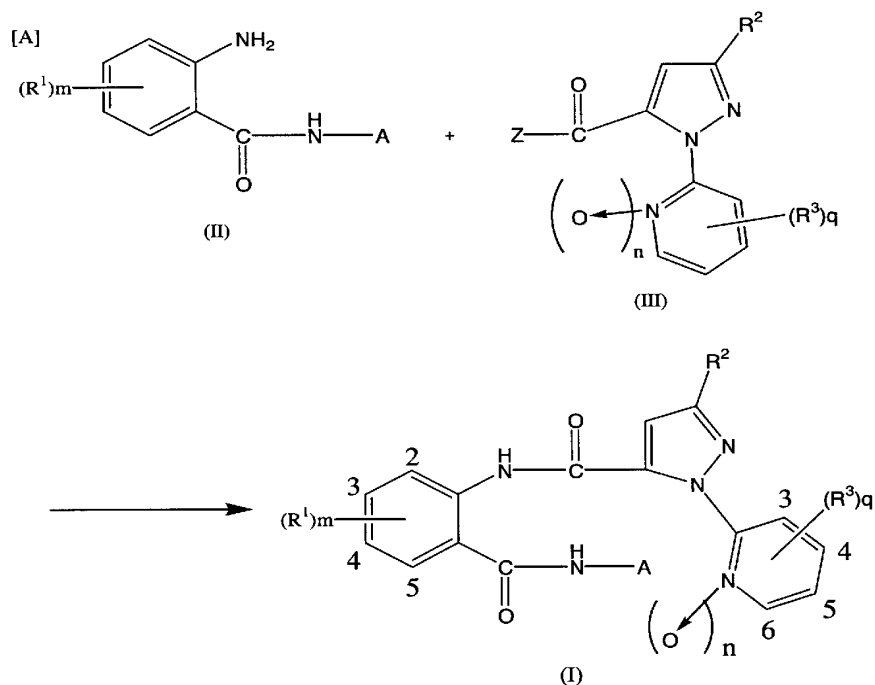
[0010] 前記式(I)のアントラニルアミド系化合物の塩としては、農業上許容されるものであ

ればあらゆるものが含まれる。例えば、ナトリウム塩、カリウム塩のようなアルカリ金属塩；マグネシウム塩、カルシウム塩のようなアルカリ土類金属塩；ジメチルアンモニウム塩、トリエチルアンモニウム塩のようなアンモニウム塩；塩酸塩、過塩素酸塩、硫酸塩、硝酸塩のような無機酸塩；酢酸塩、メタンスルホン酸塩のような有機酸塩などが挙げられる。

[0011] 前記式(I)のアントラニルアミド系化合物には、光学異性体、幾何異性体のような異性体が存在する場合があるが、本発明には各異性体及び異性体混合物の双方が含まれる。尚、本発明には、当該技術分野における技術常識の範囲内において、前記したもの以外の各種異性体も含まれる。また、異性体の種類によっては、前記式(I)とは異なる化学構造となる場合があるが、当業者であればそれらが異性体の関係にあることが十分認識できる為、本発明の範囲内であることは明らかである。

前記式(I)のアントラニルアミド系化合物又はその塩(以下本発明化合物と略す)は、以下の反応[A]～[B]と、通常の塩の製造方法に従って製造することができる。

[0012] [化2]



[0013] R^1 、 R^2 、 R^3 、 A 、 m 、 n 及び q は前述の通りであり、 Z は塩素原子、 $-\text{OH}$ 又は C_{1-4} アルコキシである。

反応[A]は、Zが塩素原子である場合、通常塩基の存在下で行うことができる。

塩基としては、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムのようなアルカリ金属水酸化物；炭酸ナトリウム、炭酸カリウムのようなアルカリ金属炭酸塩；水素化ナトリウム、水素化カリウムのようなアルカリ金属水素化物；トリメチルアミン、トリエチルアミン、トリイソプロピルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、ピリジン、4-ジメチルアミノピリジン、2,6-ジメチルピリジン、4-ピロリジノピリジン、N-メチルモルホリン、N,N-ジメチルアニリン、N,N-ジエチルアニリン、N-エチル-N-メチルアニリン、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]-7-ウンデセン、1,4-ジアザビシクロ[2.2.2]オクタンのような第三級アミン類などから1種又は2種以上を適宜選択することができる。塩基は、式(II)の化合物に対して1-5倍モル、望ましくは1-2.5倍モル使用することができる。

[0014] 反応[A]は、Zが塩素原子である場合、所望により溶媒の存在下で行うことができる。溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよい。例えば、ジエチルエーテル、ブチルエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタンのようなエーテル類；クロロベンゼン、ジクロロベンゼン、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、ジクロロエタン、トリクロロエタン、ジクロロエチレンのようなハロゲン化炭化水素類；ベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類；アセトニトリル、プロピオニトリル、N,N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ヘキサメチルホスホリックトリアミド、スルホラン、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドンのような極性非プロトン性溶媒；酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸プロピルのようなエステル類；アセトン、ジエチルケトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトンのようなケトン類などから1種又は2種以上を適宜選択することができる。

[0015] 反応[A]は、Zが塩素原子である場合、通常-20-+60℃、望ましくは0-30℃で行うことができる。その反応時間は、通常1-24時間程度、望ましくは2-12時間程度とすることができる。

[0016] 反応[A]は、Zが-OHである場合、通常、脱水縮合剤及び溶媒の存在下で行うことができる。

脱水縮合剤としては、N,N'-ジシクロヘキシルカルボジイミド、1,3-ジイソプロピルカルボジイミド、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩のよ

うなカルボジイミド類;その他に、1,1'-カルボニル-ビス-1H-イミダゾール、リン酸ジクロリドフェニルエステル、ジエチルホスホロシアニダート、1,3,5-トリアザ-2,4,6-トリホスホリン-2,2,4,4,6,6-ヘキサクロリド、シアヌリッククロリド、クロロギ酸イソブチル、クロスルホニルイソシアネート、トリフルオロ酢酸無水物などが挙げられる。

- [0017] 溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよい。例えば、ジエチルエーテル、ブチルエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタンのようなエーテル類;クロロベンゼン、ジクロロベンゼン、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、ジクロロエタン、トリクロロエタン、ジクロロエチレンのようなハロゲン化炭化水素類;ベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類;アセトニトリル、プロピオニトリル、N,N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ヘキサメチルホスホリクトリアミド、スルホラン、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドンのような極性非プロトン性溶媒;酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸プロピルのようなエステル類;アセトン、ジエチルケトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトンのようなケトン類;ペンタン、ヘキサン、ヘプタン、オクタン、シクロヘキサンのような脂肪族炭化水素類などから1種又は2種以上を適宜選択することができる。

- [0018] 反応[A]は、Zが-OHである場合、通常-20〜+60℃、望ましくは0〜30℃で行うことができる。その反応時間は、通常0.5〜24時間程度、望ましくは1〜12時間程度とすることができる。

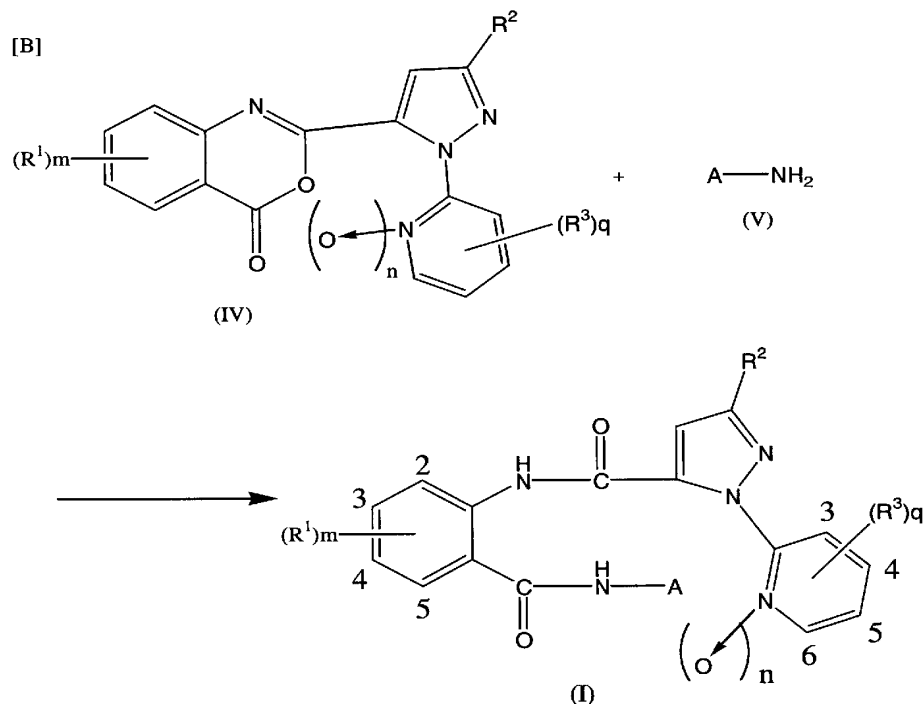
- [0019] 反応[A]は、ZがC₁₋₄ アルコキシである場合、通常、塩基及び溶媒の存在下で行うことができる。

塩基としては、水素化ナトリウム、水素化カリウムのようなアルカリ金属水素化物;ナトリウムメキシド、ナトリウムエトキシド、カリウム第3級ブトキシドのようなアルカリ金属アルコキシド;トリメチルアミン、トリエチルアミン、トイソプロピルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、ピリジン、4-ジメチルアミノピリジン、2,6-ジメチルピリジン、4-ピロリジノピリジン、N-メチルモルホリン、N,N-ジメチルアニリン、N,N-ジエチルアニリン、N-エチル-N-メチルアニリン、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]-7-ウンデセン、1,4-ジアザビシクロ[2.2.2]オクタンのような第三級アミン類などから1種又は2種以上を適宜選択することができる。塩基は、式(II)の化合物に対して1〜5倍モル、望ましくは1

ー2.5倍モル使用することができる。

- [0020] 溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよい。例えば、ジエチルエーテル、ブチルエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタンのようなエーテル類；ベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類；アセトニトリル、プロピオニトリル、N,N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ヘキサメチルホスホリクトリアミド、スルホラン、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドンのような極性非プロトン性溶媒；メタノール、エタノール、プロパノール、ノルマルブタノール、ターシャリーブタノールのようなアルコール類などから1種又は2種以上を適宜選択することができる。
- [0021] 反応[A]は、ZがC₁₋₄ アルコキシである場合、通常0ー120℃、望ましくは20ー80℃で行うことができる。その反応時間は、通常0.5ー24時間程度、望ましくは1ー12時間程度とすることができる。
- [0022] 前記式(II)又は式(III)の化合物は、それぞれ公知化合物であるか、或は公知資料に準じて製造することができる。例えば、式(II)の化合物は、Synthesis、1980年、505頁に記載された方法又はそれに準じて製造することができる。式(III)の化合物は、WO03/24222中のスキーム9ー22に記載された方法又はそれに準じて製造することができる。

[0023] [化3]



[0024] R^1, R^2, R^3, A, m, n 及び q は前述の通りである。

反応[B]は、通常、溶媒の存在下で行うことができる。

溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよい。例えば、ジエチルエーテル、ブチルエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタンのようなエーテル類；クロロベンゼン、ジクロロベンゼン、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、ジクロロエタン、トリクロロエタン、ジクロロエチレンのようなハロゲン化炭化水素類；ベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類；アセトニトリル、プロピオニトリル、N,N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ヘキサメチルホスホリックトリアミド、スルホラン、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドンのような極性非プロトン性溶媒などから1種又は2種以上を適宜選択することができる。

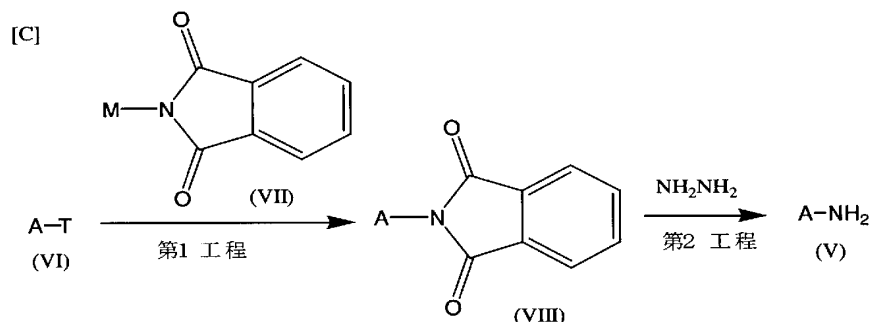
[0025] 反応[B]は、通常0〜120℃、望ましくは20〜80℃で行うことができる。その反応時間は、通常0.5〜24時間程度、望ましくは1〜12時間程度とすることができる。

前記式(IV)の化合物は、公知化合物であるか、或は公知資料に準じて製造することができる。例えば、式(IV)の化合物は、Org. Prep. Proceed. Int., 1993年、25巻、585頁に記載された方法、WO03/24222中のスキーム8-10に記載された方法

又はそれらに準じて製造することができる。

前記式(V)の化合物には新規化合物が含まれる。当該化合物はGabriel法にて製造可能であるが、例えば以下の反応[C]に従って製造することができる。

[0026] [化4]



[0027] 反応[C]において、Aは前述の通りであり、Tはハロゲン、 $-\text{OSO}_2\text{G}$ (Gはスルホン酸エステル残基) 又は $-\text{OH}$ である。Tがハロゲン又は $-\text{OSO}_2\text{G}$ のとき、Mはナトリウム又はカリウムであり、Tが $-\text{OH}$ のとき、Mは水素原子である。前記スルホン酸エステル残基としては、例えばメチル、エチルのような C_{1-6} のアルキル; C_{1-6} のアルキルで置換されてもよいフェニルなどが挙げられる。

[0028] 反応[C]の第1工程は、Tがハロゲン又は $-\text{OSO}_2\text{G}$ であり、且つMがナトリウム又はカリウムである場合、通常溶媒の存在下で行うことができる。

溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよい。例えば、ジエチルエーテル、ブチルエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタンのようなエーテル類;ベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類;アセトニトリル、プロピオニトリル、N,N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ヘキサメチルホスホリクトリアミド、スルホラン、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドンのような極性非プロトン性溶媒;メタノール、エタノール、プロパノール、ノルマルブタノール、ターシャリーブタノールのようなアルコール類などから1種又は2種以上を適宜選択することができる。

[0029] 反応[C]の第1工程は、Tがハロゲン又は $-\text{OSO}_2\text{G}$ であり、且つMがナトリウム又はカリウムである場合、通常 $0-150^\circ\text{C}$ 、望ましくは $30-110^\circ\text{C}$ で行うことができる。その反応時間は、通常 $0.5-24$ 時間程度、望ましくは $1-12$ 時間程度とすることができる。

。

- [0030] 反応[C]の第1工程は、Tが—OHであり、且つMが水素原子である場合、通常、光延法に従って行うことができる。例えば、溶媒の存在下、ジアルキルアゾジカルボキシレート及びトリフェニルホスフィンを用いて行うことができる。前記ジアルキルアゾジカルボキシレートとトリフェニルホスフィンは、通常、式(VI)の化合物に対し、それぞれ等モル程度用いることができる。前記ジアルキルアゾジカルボキシレートとしては、例えばジエチルアゾジカルボキシレート、ジイソプロピルアゾジカルボキシレートなどが挙げられる。
- [0031] 溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよい。例えば、ジエチルエーテル、ブチルエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタンのようなエーテル類；クロロベンゼン、ジクロロベンゼン、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、ジクロロエタン、トリクロロエタン、ジクロロエチレンのようなハロゲン化炭化水素類；ベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類などから1種又は2種以上を適宜選択することができる。
- [0032] 反応[C]の第1工程は、Tが—OHであり、且つMが水素原子である場合、通常0〜80℃、望ましくは20〜60℃で行うことができる。その反応時間は、通常0.5〜24時間程度、望ましくは1〜16時間程度とすることができる。
- [0033] 反応[C]の第2工程は、通常、溶媒の存在下、式(VIII)の化合物を、ヒドラジンを用いて分解することにより行うことができる。前記ヒドラジンは、通常、式(VIII)の化合物に対し、等モル程度用いることができる。
- [0034] 溶媒としては、反応に不活性な溶媒であればいずれのものでもよく、例えば、ジエチルエーテル、ブチルエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタンのようなエーテル類；ベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類；メタノール、エタノール、プロパノール、ノルマルブタノール、ターシャリーブタノールのようなアルコール類などから1種又は2種以上を適宜選択することができる。
- [0035] 反応[C]の第2工程は、通常0〜140℃、望ましくは30〜100℃で行うことができる。その反応時間は、通常0.5〜24時間程度、望ましくは2〜12時間程度とすることができる。

- [0036] 本発明化合物を含有する有害生物防除剤の望ましい態様について以下に記述する。本発明化合物を含有する有害生物防除剤は、例えば農園芸分野で問題となる各種有害生物の防除剤、即ち農園芸用有害生物防除剤や、動物に寄生する有害生物の防除剤、即ち動物寄生生物防除剤として特に有用である。
- [0037] 農園芸用有害生物防除剤としては、例えば、殺虫、殺ダニ、殺線虫、殺土壌害虫剤として有用であるが、具体的には、ナミハダニ、ニセナミハダニ、カンザワハダニ、ミカンハダニ、リンゴハダニ、チャノホコリダニ、ミカンサビダニ、ネダニなどのような植物寄生性ダニ類；コナガ、ヨトウムシ、ハスモンヨトウ、コドリング、ボールワーム、タバコバッドワーム、マイマイガ、コブノメイガ、チャノコカクモンハマキ、リンゴコカクモンハマキ、モモシンクイガ、ナシヒメシンクイ、タマナヤガ、カブラヤガ、コロラドハムシ、ウリハムシ、ボールウィービル、アブラムシ類、ウンカ類、ヨコバイ類、カイガラムシ類、カメムシ類、コナジラミ類、アザミウマ類、バッタ類、ハナバエ類、コガネムシ類、アリ類、ハモグリバエ類などのような農業害虫類；ネコブセンチュウ類、シストセンチュウ類、ネグサレセンチュウ類、イネシンガレセンチュウ、イチゴメセンチュウ、マツノザイセンチュウなどのような植物寄生性線虫類；ナメクジ、マイマイなどのような腹足類；ダンゴムシ、ワラジムシなどのような等脚類などのような土壌害虫類；イエダニ、イエバエ、アカイエカ、ゴキブリ類などのような衛生害虫類；バクガ、アズキゾウムシ、コクヌストモドキ、ゴミムシダマシ類などのような貯穀害虫類；イガ、ヒメカツオブシムシ、シロアリ類などのような衣類、家屋害虫類；ケナガコナダニ、コナヒョウダニ、ミナミツメダニなどのような屋内塵性ダニ類；などの防除に有効である。なかでも、本発明化合物を含有する農園芸用有害生物防除剤は、植物寄生性ダニ類、農業害虫類、植物寄生性線虫類などの防除に特に有効である。また、本発明化合物を含有する農園芸用有害生物防除剤は、有機リン剤、カーバメート剤、合成ピレスロイド剤などの薬剤に対する各種抵抗性害虫の防除にも有効である。さらに本発明化合物は、優れた浸透移行性を有していることから、本発明化合物を含有する農園芸用有害生物防除剤を土壤に処理することによって土壤有害昆虫類、ダニ類、線虫類、腹脚類、等脚類の防除と同時に茎葉部の害虫類をも防除することができる。
- [0038] 本発明化合物を含有する有害生物防除剤の別の望ましい態様としては、前記した

植物寄生性ダニ類、農業害虫類、植物寄生性線虫類、腹足類、土壌害虫類などを総合的に防除する農園芸用有害生物防除剤が挙げられる。

[0039] 本発明化合物を含有する農園芸用有害生物防除剤は、通常該化合物と各種農業上の補助剤とを混合して粉剤、粒剤、顆粒水和剤、水和剤、水性懸濁剤、油性懸濁剤、水溶剤、乳剤、液剤、ペースト剤、エアゾール剤、微量散布剤などの種々の形態に製剤して使用されるが、本発明の目的に適合するかぎり、通常の当該分野で用いられているあらゆる製剤形態にすることができる。製剤に使用する補助剤としては、珪藻土、消石灰、炭酸カルシウム、タルク、ホワイトカーボン、カオリン、ベントナイト、カオリナイト及びセリサイトの混合物、クレー、炭酸ナトリウム、重曹、芒硝、ゼオライト、澱粉などの固型担体；水、トルエン、キシレン、ソルベントナフサ、ジオキサン、アセトン、イソホロン、メチルイソブチルケトン、クロロベンゼン、シクロヘキサン、ジメチルスルホキシド、N,N-ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチル-2-ピロリドン、アルコールなどの溶剤；脂肪酸塩、安息香酸塩、アルキルスルホコハク酸塩、ジアルキルスルホコハク酸塩、ポリカルボン酸塩、アルキル硫酸エステル塩、アルキル硫酸塩、アルキルアリール硫酸塩、アルキルジグリコールエーテル硫酸塩、アルコール硫酸エステル塩、アルキルスルホン酸塩、アルキルアリールスルホン酸塩、アリールスルホン酸塩、リグニンスルホン酸塩、アルキルジフェニルエーテルジスルホン酸塩、ポリスチレンスルホン酸塩、アルキルリン酸エステル塩、アルキルアリールリン酸塩、スチリルアリールリン酸塩、ポリオキシエチレンアルキルエーテル硫酸エステル塩、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル硫酸塩、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル硫酸エステル塩、ポリオキシエチレンアルキルエーテルリン酸塩、ポリオキシエチレンアルキルアリールリン酸エステル塩、ナフタレンスルホン酸ホルマリン縮合物の塩のような陰イオン系の界面活性剤や展着剤；ソルビタン脂肪酸エステル、グリセリン脂肪酸エステル、脂肪酸ポリグリセリド、脂肪酸アルコールポリグリコールエーテル、アセチレングリコール、アセチレンアルコール、オキシアルキレンブロッックポリマー、ポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル、ポリオキシエチレンスチリルアリールエーテル、ポリオキシエチレングリコールアルキルエーテル、ポリエチレングリコール、ポリオキシエチレン脂肪酸エス

テル、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレングリセリン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン硬化ヒマシ油、ポリオキシプロピレン脂肪酸エステルのような非イオン系の界面活性剤や展着剤；オリーブ油、カボック油、ひまし油、シユロ油、椿油、ヤシ油、ごま油、トウモロコシ油、米ぬか油、落花生油、綿実油、大豆油、菜種油、亜麻仁油、きり油、液状パラフィンなどの植物油や鉱物油などが挙げられる。これら補助剤の各成分は、本発明の目的から逸脱しないかぎり、1種又は2種以上を適宜選択して使用することができる。また、前記した補助剤以外にも当該分野で知られたものの中から適宜選んで使用することもできる。例えば、増量剤、増粘剤、沈降防止剤、凍結防止剤、分散安定剤、薬害軽減剤、防黴剤など通常使用される各種補助剤も使用することができる。本発明化合物と各種補助剤との配合割合は0.001:99.999〜95:5、望ましくは0.005:99.995〜90:10である。これら製剤の実際の使用に際しては、そのまま使用するか、または水等の希釈剤で所定濃度に希釈し、必要に応じて各種展着剤（界面活性剤、植物油、鉱物油など）を添加して使用することができる。

[0040] 本発明化合物を含有する農園芸用有害生物防除剤の施用は、気象条件、製剤形態、施用時期、施用場所、病害虫の種類や発生状況などの相違により一概に規定できないが、一般に0.05〜800000ppm、望ましくは0.5〜500000ppmの有効成分濃度で行ない、その単位面積あたりの施用量は、1ヘクタール当り本発明化合物が0.05〜50000g、望ましくは1〜30000gである。また、本発明化合物を含有する有害生物防除剤の別の望ましい態様である農園芸用の有害生物防除剤の施用は、前記有害生物防除剤の施用に準じて行われる。本発明には、このような施用方法による有害生物の防除方法、特に植物寄生性ダニ類、農業害虫類、植物寄生性線虫類の防除方法も含まれる。

[0041] 本発明化合物を含有する農園芸用有害生物防除剤の種々の製剤、またはその希釈物の施用は、通常一般に行なわれている施用方法すなわち、散布（例えば散布、噴霧、ミスティング、アトマイジング、散粒、水面施用等）、土壌施用（混入、灌注等）、表面施用（塗布、粉衣、被覆等）、浸漬毒餌等により行うことができる。また、家畜に対して前記有効成分を飼料に混合して与え、その排泄物での有害虫、特に有害昆虫

の発生及び生育を阻害することも可能である。またいわゆる超高濃度少量散布法 (ultra low volume)により施用することもできる。この方法においては、活性成分を100%含有することが可能である。

[0042] また、本発明化合物を含有する農園芸用有害生物防除剤は、他の農薬、肥料、薬害軽減剤などと混用或は併用することができ、この場合に一層優れた効果、作用性を示すことがある。他の農薬としては、除草剤、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺土壌害虫剤、殺菌剤、抗ウィルス剤、誘引剤、抗生物質、植物ホルモン、植物成長調整剤などが挙げられる。特に、本発明化合物と他の農薬の有効成分化合物の1種又は2種以上とを混用或は併用した混合有害生物防除組成物は、適用範囲、薬剤処理の時期、防除活性等を好ましい方向へ改良することが可能である。尚、本発明化合物と他の農薬の有効成分化合物は各々別々に製剤したものを散布時に混合して使用しても、両者を一緒に製剤して使用してもよい。本発明には、このような混合有害生物防除組成物も含まれる。

[0043] 本発明化合物と他の農薬の有効成分化合物との混合比は、気象条件、製剤形態、施用時期、施用場所、病虫害の種類や発生状況などの相違により一概に規定できないが、一般に1:300〜300:1、望ましくは1:100〜100:1である。また、施用適量は1ヘクタール当りの総有効成分化合物量として0.1〜50000g、望ましくは1〜30000gである。本発明には、このような混合有害生物防除組成物の施用方法による有害生物の防除方法も含まれる。

[0044] 上記他の農薬中の、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤或いは殺土壌害虫剤、すなわち害虫防除剤の有効成分化合物(一般名;一部申請中を含む)としては、例えばプロフェノホス(Profenofos)、ジクロルボス(Dichlorvos)、フェナミホス(Fenamiphos)、フェニトロチオン(Fenitrothion)、EPN、ダイアジノン(Diazinon)、クロルピリホスメチル(Chlorpyrifos-methyl)、アセフェート(Acephate)、プロチオホス(Prothiofos)、ホスチアゼート(Fosthiazate)、ホスホカルブ(Phosphocarb)、カズサホス(Cadusafos)、ジスルホトン(Disulfoton)、クロルピリホス(Chlorpyrifos)、デメトン-S-メチル(Demeton-S-methyl)、ジメトエート(Dimethoate)、メタミドホス(Methamidophos)、パラチオン(Parathion)のような有機リン酸エステル系化合物;

カルバリル(Carbaryl)、プロポキスル(Propoxur)、アルジカルブ(Aldicarb)、カルボフラン(Carbofuran)、チオジカルブ(Thiodicarb)、メソミル(Methomyl)、オキサミル(Oxamyl)、エチオフェンカルブ(Ethiofencarb)、ピリミカルブ(Pirimicarb)、フェノブカルブ(Fenobucarb)、カルボスルフアン(Carbosulfan)、ベンフラカルブ(Benfuracarb)のようなカーバメート系化合物;

カルタップ(Cartap)、チオシクラム(Thiocyclam)、ベンスルタップ(Bensultap)のようなネライストキシシン誘導体;

ジコホル(Dicofol)、テトラジホン(Tetradifon)、エンドスルフアン(Endosulfan)のような有機塩素系化合物;

酸化フェンブタスズ(Fenbutatin Oxide)のような有機金属系化合物;
フェンバレレート(Fenvalerate)、ペルメトリン(Permethrin)、シペルメトリン(Cypermethrin)、デルタメトリン(Deltamethrin)、シハロトリン(Cyhalothrin)、テフルトリン(Tefluthrin)、エトフェンプロックス(Ethofenprox)、フェンプロパトリン(Fenpropathrin)、ビフェントリン(Bifenthrin)のようなピレスロイド系化合物;

ジフルベンズロン(Diflubenzuron)、クロルフルアズロン(Chlorfluazuron)、テフルベンズロン(Teflubenzuron)、フルフェノクスロン(Flufenoxuron)、ルフエヌロン(Lufenuron)、ノバルロン(Novaluron)、ビストリフルロン(Bistrifluron)、ノビフルムロン(Noviflumuron)のようなベンゾイルウレア系化合物;

メトブレン(Methoprene)、ピリプロキシフェン(Pyriproxyfen)、フェノキシカルブ(Fenoxycarb)のような幼若ホルモン様化合物;

ピリダベン(Pyridaben)のようなピリダジノン系化合物;

フェンピロキシメート(Fenpyroximate)、フィプロニル(Fipronil)、テブフェンピラド(Tebufenpyrad)、エチピロール(Ethiprole)、トルフェンピラド(Tolfenpyrad)、アセトプロール(Acetoprole)、ピラフルプロール(Pyrafluprole)、ピリプロール(Pyriprole)のようなピラゾール系化合物;

イミダクロプリド(Imidacloprid)、ニテンピラム(Nitenpyram)、アセタミプリド(Acetamiprid)、チアクロプリド(Thiacloprid)、チアメトキサム(Thiamethoxam)、クロチアニジン(Clothianidin)、ジノテフラン(Dinotefuran)などのネオニコチノイド;

テブフェノジド(Tebufenozide)、メトキシフェノジド(Methoxyfenozide)、クロマフェノジド(Chromafenozide)、ハロフェノジド(Halofenozide)などのヒドラジン系化合物;

ジニトロ系化合物、有機硫黄化合物、尿素系化合物、トリアジン系化合物、ヒドラジン系化合物また、その他の化合物として、フロニカミド(Flonicamid)、ブプロフェジン(Buprofezin)、ヘキシチアゾクス(Hexythiazox)、アミトラズ(Amitraz)、クロルジメホルム(Chlordimeform)、シラフルオフエン(Silafluofen)、トリアザメイト(Triazamate)、ピメトロジン(Pymetrozone)、ピリミジフェン(Pyrimidifen)、クロルフェナピル(Chlorfenapyr)、インドキサカルブ(Indoxacarb)、アセキノシル(Acequinocyl)、エトキサゾール(Etoxazole)、シロマジン(Cyromazine)、1,3-ジクロロプロペン(1,3-dichloropropene)、ジアフェンチウロン(Diafenthiuron)、ベンクロチアズ(Benclothiaz)、フルフェンリム(Flufenerim)、ピリダリル(Pyridalyl)、スピロジクロフェン(Spirodiclofen)、ビフェナゼート(Bifenazate)、スピロメシフェン(Spiromesifen)、プロパルギット(Propargite)、クロフェンテジン(Clofentezine)、フルアクリピリム(Fluacrypyrim)、フルベンジアミド(Flubendiamide)、シフルメトフェン(Cyflumetofen)、メタフルミゾン(Metaflumizone)、アミドフルメット(Amidoflumet)のような化合物;などが挙げられる。更に、BT剤、昆虫病原ウイルス剤、昆虫病原糸状菌剤、線虫病原糸状菌剤などのような微生物農薬;アベルメクチン(Avermectin)、エマメクチンベンゾエート(Emamectin-Benzoate)、ミルベメクチン(Milbemectin)、スピノサッド(Spinosad)、イベルメクチン(Ivermectin)、レピメクチン(Lepimectin)のような抗生物質;アザディラクチン(Azadirachtin)、ロテノン(Rotenone)のような天然物などと、混用、併用することもできる。

[0045] 上記他の農薬中の、殺菌剤の有効成分化合物(一般名;一部申請中を含む)としては、例えば、メパニピリム(Mepanipyrim)、ピリメサニル(Pyrimethanil)、シプロジニル(Cyprodinil)のようなピリミジナミン系化合物;

トリアジメホン(Triadimefon)、ビテルタノール(Bitertanol)、トリフルミゾール(Triflumizole)、エタコナゾール(Etaconazole)、プロピコナゾール(Propiconazole)、ペンコナゾール(Penconazole)、フルシラゾール(Flusilazole)、マイクロブタニル(Myclobutanil)、シプロコナゾール(Cyproconazole)、ターブコナゾール(Terbuconazole)、ヘキサコナゾール(Hexaconazole)、ファーコナゾールシス

(Furconazole-cis)、プロクロラズ(Prochloraz)、メトコナゾール(Metconazole)、エポキシコナゾール(Epoxiconazole)、テトラコナゾール(Tetraconazole)、オキシポコナゾール(Oxpoconazole)、シプコナゾール(Sipconazole)のようなアゾール系化合物；

キノメチオネート(Quinomethionate)のようなキノキサリン系化合物；

マンネブ(Maneb)、ジネブ(Zineb)、マンゼブ(Mancozeb)、ポリカーバメート(Polycarbamate)、プロピネブ(Propineb)のようなジチオカーバメート系化合物；

フサライド(Fthalide)、クロロタロニル(Chlorothalonil)、キントゼン(Quintozene)のような有機塩素系化合物；

ベノミル(Benomyl)、チオファネートメチル(Thiophanate-Methyl)、カーベンダジム(Carbendazim)、シアゾファミド(Cyazofamid)のようなイミダゾール系化合物；

フルアジナム(Fluazinam)のようなピリジナミン系化合物；

シモキサニル(Cymoxanil)のようなシアノアセトアミド系化合物；

メタラキシル(Metalaxyl)、オキサジキシル(Oxadixyl)、オフレース(Ofurace)、ベナラキシル(Benalaxyl)、フララキシル(Furalaxyl)、シプロフラム(Cyprofuram)のようなフェニルアミド系化合物；

ジクロフルアニド(Dichlofluanid)のようなスルフェン酸系化合物；

水酸化第二銅(Cupric hydroxide)、有機銅(Oxine Copper)のような銅系化合物；

ヒドロキシイソキサゾール(Hydroxyisoxazole)のようなイソキサゾール系化合物；

ホセチルアルミニウム(Fosetyl-Al)、トルクロホスメチル(Tolclofos-Methyl)、S-ベンジル O,O-ジイソプロピルホスホロチオエート、O-エチル S,S-ジフェニルホスホロジチオエート、アルミニウムエチルハイドロゲンホスホネートのような有機リン系化合物；

キャプタン(Captan)、キャプタホル(Captafol)、フォルペット(Folpet)のようなN-ハロゲンチオアルキル系化合物；

プロシミドン(Procymidone)、イプロジオン(Iprodione)、ビンクロゾリン(Vinclozolin)のようなジカルボキシイミド系化合物；

フルトラニル(Flutolanil)、メプロニル(Mepronil)、ゾキサミド(Zoxamide)のようなベンズアニリド系化合物；

トリホリン(Triforine)のようなピペラジン系化合物；
ピリフェノックス(PyrifenoX)のようなピリジン系化合物；
フェナリモル(Fenarimol)、フルトリアフォル(Flutriafol)のようなカルビノール系化合物
；
フェンプロピジン(Fenpropidine)のようなピペリジン系化合物；
フェンプロピモルフ(Fenpropimorph)のようなモルフォリン系化合物；
フェンチンヒドロキシド(Fentin Hydroxide)、フェンチンアセテート(Fentin
Acetate)のような有機スズ系化合物；
ペンシキュロン(Pencycuron)のような尿素系化合物；
ジメトモルフ(Dimethomorph)のようなシンナミック酸系化合物；
ジエトフェンカルブ(Diethofencarb)のようなフェニルカーバメート系化合物；
フルジオキシニル(Fludioxonil)、フェンピクロニル(Fenpiclonil)のようなシアノピロール
系化合物；
アゾキシストロビン(Azoxystrobin)、クレソキシムメチル(Kresoxim-Methyl)、メミノフ
エン(Metominofen)、トリフロキシストロビン(Trifloxystrobin)、ピコキシストロビン
(Picoxystrobin)、ピラクロストロビン (Pyraclostrobin) のようなストロビルリン系化合物；
ファモキサドン(Famoxadone)のようなオキサゾリジノン系化合物；
エタボキサム(Ethaboxam)のようなチアゾールカルボキサミド系化合物；
シルチオフアム(Silthiopham)のようなシリルアミド系化合物；
イプロバリカルブ(Iprovalicarb)のようなアミノアシッドアミドカーバメート系化合物；
フェナミドン(Fenamidone)のようなイミダゾリジン系化合物；
フェンヘキサミド(Fenhexamid)のようなヒドロキシアニリド系化合物；
フルスルファミド(Flusulfamide)のようなベンゼンスルホンアミド系化合物；
アトラキノン系化合物；クロトン酸系化合物；抗生物質またその他の化合物として、イ
ソプロチオラン(Isoprothiolane)、トリシクラゾール(Tricyclazole)、ピロキロン
(Pyroquilon)、ジクロメジン(Diclomezine)、プロベナゾール(Probenazole)、キノキシフェ
ン(Quinoxifen)、プロパモカルブ塩酸塩(Propamocarb
Hydrochloride)、スピロキサミン(Spiroxamine)、クロロピクリン(Chloropicrin)、ダゾメット

(Dazomet)、メタムナトリウム塩(Metam-sodium);などが挙げられる。

- [0046] その他、本発明化合物と混用或いは併用することが可能な農薬としては、例えば、Farm Chemicals Handbook (2002年版)に記載されているような除草剤の有効成分化合物、特に土壌処理型のものなどがある。

- [0047] 動物寄生生物防除剤としては、例えば、宿主動物の体表(背、腋下、下腹部、内股部など)に寄生する外部寄生生物や、宿主動物の体内(胃、腸管、肺、心臓、肝臓、血管、皮下、リンパ組織など)に寄生する内部寄生生物の防除に有効であるが、なかでも、外部寄生生物の防除に有効である。

外部寄生生物としては、例えば、動物寄生性のダニやノミなどが挙げられる。これらの種類は非常に多く、全てを列記することが困難であるので、その一例を挙げる。

- [0048] 動物寄生性のダニとしては、例えばオウシマダニ(Boophilus microplus)、クリイロコイタマダニ(Rhipicephalus sanguineus)、フタトゲチマダニ(Haemaphysalis longicornis)、キチマダニ(Haemaphysalis flava)、ツリガネチマダニ(Haemaphysalis campanulata)、イスカチマダニ(Haemaphysalis concinna)、ヤマトチマダニ(Haemaphysalis japonica)、ヒゲナガチマダニ(Haemaphysalis kitaokai)、イヤスチマダニ(Haemaphysalis ias)、ヤマトマダニ(Ixodes ovatus)、タネガタマダニ(Ixodes nipponensis)、シュルツエマダニ(Ixodes persulcatus)、タカサゴキラマダニ(Amblyomma testudinarium)、オオトゲチマダニ(Haemaphysalis megaspinosa)、アミノカクマダニ(Dermacentor reticulatus)、タイワンカクマダニ(Dermacentor taiwanesis)のようなマダニ類;ワクモ(Dermanyssus gallinae);トリサシダニ(Ornithonyssus sylviarum)、ミナミトリサシダニ(Ornithonyssus bursa)のようなトリサシダニ類;ナンヨウツツガムシ(Eutrombicula wichmanni)、アカツツガムシ(Leptotrombidium akamushi)、フトゲツツガムシ(Leptotrombidium pallidum)、フジツツガムシ(Leptotrombidium fuji)、トサツツガムシ(Leptotrombidium tosa)、ヨーロッパアキダニ(Neotrombicula autumnalis)、アメリカツツガムシ(Eutrombicula alfreddugesi)、ミヤガワタマツツガムシ(Helenicula miyagawai)のようなツツガムシ類;イヌツメダニ(Cheyletiella yasguri)、ウサギツメダニ(Cheyletiella parasitivorax)、ネ

コツメダニ (Cheyletiella blakei) のようなツメダニ類; ウサギキューセンダニ (Psoroptes cuniculi)、ウシシヨクヒダニ (Chorioptes bovis)、イヌミミヒゼンダニ (Otodectes cynotis)、ヒゼンダニ (Sarcoptes scabiei)、ネコシヨウセンコウヒゼンダニ (Notoedres cati) のようなヒゼンダニ類; イヌニキビダニ (Demodex canis) のようなニキビダニ類などが挙げられる。なかでも、本発明化合物を含有する動物寄生生物防除剤は、マダニ類などの防除に特に有効である。

[0049] ノミとしては、例えば、ノミ目 (Siphonaptera) に属する外部寄生性無翅昆虫、より具体的には、ヒトノミ科 (Pulicidae)、ナガノミ科 (Ceratephyllus) などに属するノミ類が挙げられる。ヒトノミ科に属するノミ類としては、例えば、イヌノミ (Ctenocephalides canis)、ネコノミ (Ctenocephalides felis)、ヒトノミ (Pulex irritans)、ニワトリフトノミ (Echidnophaga gallinacea)、ケオプスネズミノミ (Xenopsylla cheopis)、メクラネズミノミ (Leptopsylla segnis)、ヨーロッパネズミノミ (Nosopsyllus fasciatus)、ヤマトネズミノミ (Monopsyllus anisus) などが挙げられる。なかでも、本発明化合物を含有する動物寄生生物防除剤は、ヒトノミ科に属するノミ類、特にイヌノミ、ネコノミなどの防除に有効である。

[0050] その他の外部寄生生物としては、例えば、ウシジラミ、ウマジラミ、ヒツジジラミ、ウシホソジラミ、アタマジラミのようなシラミ類; イヌハジラミのようなハジラミ類; ウシアブ、ウアイヌカカ、ツメトゲブユのような吸血性双翅目害虫などが挙げられる。また、内部寄生生物としては、例えば、肺虫、ベンチュウ、結節状ウオーム、胃内寄生虫、回虫、糸状虫類のような線虫類; マンソン裂頭条虫、広節裂頭条虫、瓜実条虫、多頭条虫、単包条虫、多包条虫のような条虫類; 日本住血吸虫、肝蛭のような吸虫類; コクシジウム、マラリア原虫、腸内肉胞子虫、トキソプラズマ、クリプトスポリジウムのような原生動物などが挙げられる。

[0051] 宿主動物としては、種々の愛玩動物、家畜、家禽などが挙げられ、より具体的には、イヌ、ネコ、マウス、ラット、ハムスター、モルモット、リス、ウサギ、フェレット、鳥 (例えば、ハト、オウム、九官鳥、文鳥、インコ、ジュウシマツ、カナリアなど)、ウシ、ウマ、ブタ、ヒツジ、アヒル、ニワトリなどが挙げられる。なかでも、本発明化合物を含有する動物寄生生物防除剤は、愛玩動物又は家畜に寄生する有害生物、特に外部寄生生物

の防除に有効である。愛玩動物又は家畜の中ではイヌ、ネコ、ウシ又はウマに特に有効である。

[0052] 本発明化合物を動物寄生生物防除剤として使用する際、そのまま使用してもよく、また、適当な補助剤と共に粉剤、粒剤、錠剤、散剤、カプセル剤、液状剤、乳剤、水生懸濁剤、油性懸濁剤などの種々の形態に製剤して使用することもできる。尚、前記製剤形態以外にも、本発明の目的に適合するかぎり、通常の当該分野で用いられているあらゆる製剤形態にすることができる。製剤に使用する補助剤としては、前記した農園芸用有害生物防除剤の製剤用補助剤として例示した陰イオン系の界面活性剤や非イオン系の界面活性剤；セチルトリメチルアンモニウムブロミドのような陽イオン系の界面活性剤；水、アセトン、アセトニトリル、モノメチルアセトアミド、ジメチルアセトアミド、ジメチルホルムアミド、2-ピロリドン、N-メチル-2-ピロリドン、ケロシン、トリアセチン、メタノール、エタノール、イソプロパノール、ベンジルアルコール、エチレングリコール、プロピレングリコール、ポリエチレングリコール、液体ポリオキシエチレングリコール、ブチルジグリコール、エチレングリコールモノメチルエーテル、エチレングリコールモノエチルエーテル、ジエチレングリコールモノエチルエーテル、ジエチレングリコールノルマルブチルエーテル、ジプロピレングリコールモノメチルエーテル、ジプロピレングリコールノルマルブチルエーテルのような溶剤；ブチルヒドロキシアニソール、ブチルヒドロキシトルエン、アスコルビン酸、メタ亜硫酸水素ナトリウム、プロピル没食子酸塩、チオ硫酸ナトリウムのような酸化防止剤；ポリビニルピロリドン、ポリビニルアルコール、酢酸ビニルとビニルピロリドンのコポリマーのような被膜形成剤；前記した農園芸用有害生物防除剤の製剤用補助剤として例示した植物油や鉱物油；乳糖、蔗糖、ブドウ糖、澱粉、麦粉、コーン粉、大豆油粕、脱脂米糠、炭酸カルシウム、その他市販の飼料原料のような担体などが挙げられる。これら補助剤の各成分は、本発明の目的から逸脱しないかぎり、1種又は2種以上を適宜選択して使用することができる。また、前記した補助剤以外にも当該分野で知られたものの中から適宜選択して使用することもでき、更には、前記した農園芸分野で使用される各種補助剤などから適宜選択して使用することもできる。

[0053] 本発明化合物と各種補助剤との配合割合は、通常0.1:99.9〜90:10程度である。こ

れら製剤の実際の使用に際しては、そのまま使用するか、または水等の希釈剤で所定濃度に希釈し、必要に応じて各種展着剤(界面活性剤、植物油、鉱物油など)を添加して使用することができる。

[0054] 宿主動物への本発明化合物の投与は、経口又は非経口によって行われる。経口投与方法としては、例えば本発明化合物を含有する錠剤、液状剤、カプセル剤、ウェハース、ビスケット、ミンチ肉、その他の飼料等を投与する方法などが挙げられる。非経口投与方法としては、例えば本発明化合物を適当な製剤に調製した上で、静注投与、筋肉内投与、皮内投与、皮下投与等により体内に取り込ませる方法;スポットオン(spot-on)処理、ポワオン(pour-on)処理、スプレー処理等により体表面に投与する方法;宿主動物の皮下に本発明化合物を含有する樹脂片等を埋め込む方法などが挙げられる。

[0055] 宿主動物への本発明化合物の投与量は、投与方法、投与目的、疾病症状等によって異なるが、通常、宿主動物の体重1Kgに対して0.01mg〜100g、望ましくは0.1mg〜10gの割合で投与するのが適当である。

本発明には、前記したような投与方法又は投与量による有害生物の防除方法、特に外部寄生生物又は内部寄生生物の防除方法も含まれる。

また、本発明においては、前述のようにして動物寄生性の有害生物を防除することにより、それらに起因する宿主動物の各種疾患を予防又は治療できる場合がある。このように、本発明には、本発明化合物を有効成分として含有する寄生生物起因動物疾患の予防又は治療剤並びに、寄生生物起因動物疾患を予防又は治療する方法も含まれる。

[0056] 本発明化合物を動物寄生生物防除剤として使用する際、補助剤と共に各種ビタミン類、ミネラル類、アミノ酸類、栄養剤、酵素製剤、解熱剤、鎮静剤、消炎剤、殺菌剤、着色剤、芳香剤、保存剤等と混用又は併用することができる。また、必要に応じて他の各種動物薬や農薬、例えば駆虫剤、抗コクシジウム剤、殺虫剤、殺ダニ剤、殺ノミ剤、殺線虫剤、殺菌剤、抗菌剤などと混用又は併用することができ、この場合に一層優れた効果を示すこともある。本発明には、前記したような各種成分を混用又は併用した混合有害生物防除組成物が含まれ、また、それを使用した有害生物の防除方

法、特に外部寄生生物又は内部寄生生物の防除方法も含まれる。

[0057] 次に本発明化合物の望ましい態様として、いくつかを例示する。例示したものの内、下記の(1)～(8)については、任意の2以上を適宜組み合わせることもでき、その組み合わせに基づく化合物も、本発明化合物の望ましい態様である。また、以下の化合物を有効成分として含有する有害生物防除剤、同じく農園芸用有害生物防除剤、同じく殺虫、殺ダニ又は殺線虫剤、同じく動物寄生生物防除剤、同じく動物外部寄生性生物の防除剤、同じく寄生生物起因動物疾患の予防又は治療剤も、本発明における望ましい態様である。また、以下の化合物の有効量を施用して有害生物を防除する方法も、本発明における望ましい態様である。但し、本発明はこれらに限定されるものではない。

- [0058] (1) R^1 の少なくとも1つが4位に置換しており、その R^1 がフッ素原子又は塩素原子である前記式(I)の化合物。
- (2) R^1 の少なくとも1つが4位に置換しており、その R^1 が塩素原子である前記式(I)の化合物。
- (3) R^1 の少なくとも1つが4位に置換しており、その R^1 がアルキル、ハロアルキル、アルケニル、ハロアルケニル、アルキニル、ハロアルキニル、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルキルカルボニル、ハロアルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、ハロアルコキシカルボニル、置換されてもよいフェノキシカルボニル、ニトロ又はホルミルである前記式(I)の化合物。
- (4) R^2 がハロゲン、ハロアルキル又はハロアルコキシである前記式(I)の化合物。
- (5) R^3 がハロゲンである前記式(I)の化合物。
- (6) R^3 がハロゲンであり、3-又は5-モノ置換であるか、或は3,5-ジ置換である前記式(I)の化合物。

- [0059] (7) Yがシクロプロピルである前記式(I)の化合物。
- (8) Yがシクロプロピルであり、そのシクロプロピルが、ハロゲン、アルキル及びハロアルキルよりなる群から選ばれる1～5の置換基で置換されている前記式(I)の化合物。
- (9) R^1 がハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルキルカルボニル又はホルミルであり; R^2 がハロゲン、ハロアルキル又はハロアルコキシであり; R^3 がハロゲン又はハロアル

キルであり;AがYで置換されたアルキルであり;Yがハロゲン及びアルキルよりなる群から選ばれる少なくとも1つの置換基で置換されてもよいシクロプロピルであり;mが1又は2であり;nが0であり;qが1である前記式(I)の化合物。

(10) R^1 が2-モノ置換又は2,4-ジ置換であり、 R^3 が3-モノ置換である上記(9)に記載の化合物。

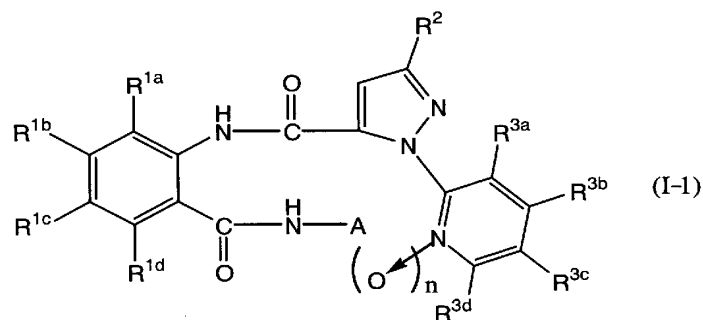
[0060] (11) R^1 がハロゲン、アルキル又はハロアルキルであり、 R^2 がハロゲン、ハロアルキル又はハロアルコキシであり、 R^3 がハロゲンであり、AがYで置換されたアルキルであり、Yがシクロプロピルであり、mが2であり、nが0であり、qが1である前記式(I)の化合物。

(12) R^1 が2,4-ジ置換であり、 R^3 が3-モノ置換である上記(11)に記載の化合物。

(13) 4位の R^1 が塩素原子である上記(12)に記載の化合物。

(14) 式(I)が式(I-1):

[0061] [化5]



[0062] であり、 R^{1a} がハロゲン又はアルキルであり; R^{1b} 及び R^{1d} が各々水素原子であり; R^{1c} がアルキル、ハロアルキル、アルケニル、ハロアルケニル、アルキニル、ハロアルキニル、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルキルカルボニル、ハロアルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、ハロアルコキシカルボニル、置換されてもよいフェノキシカルボニル、ニトロ又はホルミルであり; R^2 がハロゲン、ハロアルキル又はハロアルコキシであり; R^{3a} がハロゲン又はハロアルキルであり; R^{3b} 、 R^{3c} 及び R^{3d} が各々水素原子であり;AがYで置換されたアルキルであり;Yがハロゲン、アルキル及びハロアルキルよりなる群から選ばれる1-5の置換基で置換されてもよいシクロプロピルであり;nが0である化合物。

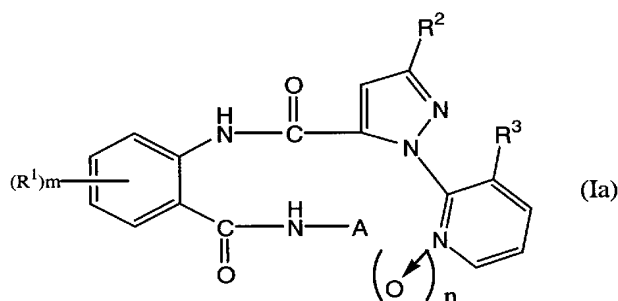
(15) R^{1c} がハロアルキル、アルキルカルボニル又はホルミルである上記(14)に記載の化合物。

(16) R^{1c} がハロアルキルである上記(14)に記載の化合物。

(17) Yがシクロプロピルである上記(14)に記載の化合物。

(18) 式(I)が式(Ia)：

[0063] [化6]



[0064] であり、 R^1 がハロゲン又はアルキルであり； R^2 及び R^3 が各々ハロゲン又は $-CF_3$ であり；AがYで置換されたアルキルであり；Yがハロゲン若しくはアルキルで置換されてもよいC3-4シクロアルキルであり；mが1又は2であり；nが0又は1である化合物。

(19) 式(I)が前記式(Ia)であり、 R^1 がハロゲン又はアルキルであり； R^2 及び R^3 が各々独立してハロゲン又は $-CF_3$ であり；Aが $-X-Y$ であり；Xがアルキレンであり；Yがハロゲン若しくはアルキルで置換されてもよいC3-4シクロアルキルであり；mが1又は2であり；nが0又は1である化合物。

実施例

[0065] 次に本発明の実施例を記載するが、本発明はこれらに限定されるものではない。まず本発明化合物の合成例を記載する。

合成例1

N-[6-[[[(シクロプロピルメチル)アミノ]カルボニル]-2-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジル)-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド(後記化合物No.1)の合成

シクロプロピルメチルアミン塩酸塩0.8g及びテトラヒドロフラン40mlの混合溶液に、氷冷下でトリエチルアミン1.49gを徐々に滴下した後、室温で30分間攪拌した。次に

2-[1-(3-クロロ-2-ピリジル)-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-5-イル]-8-メチル-4H-3,1-ベンゾオキサジン-4-オン1g及びテトラヒドロフラン10mlの混合溶液を徐々に滴下した。滴下終了後、混合溶液を還流下に4時間反応させた。反応終了後、溶媒を減圧下に留去し、残渣に酢酸エチルと水とを加えて抽出した。有機層を水及び飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムを加えて乾燥した。溶媒を減圧下に留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶離液：n-ヘキサン／酢酸エチル＝1／1）で精製して、融点199.4℃の目的物0.54gを得た。

[0066] 合成例2

N-[4-クロロ-2-メチル-6-[[α -メチル-(シクロプロピルメチル)アミノ]カルボニル]-フェニル]-3-(トリフルオロメチル)-1-(3-クロロ-2-ピリジル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド（後記化合物No.3）の合成

α -メチル-シクロプロピルメチルアミン塩酸塩0.82g及びテトラヒドロフラン40mlの混合溶液に、氷冷下でトリエチルアミン1.37gを徐々に滴下した後、室温で30分間攪拌した。次に2-[1-(3-クロロ-2-ピリジル)-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-5-イル]-6-クロロ-8-メチル-4H-3,1-ベンゾオキサジン-4-オン1g及びテトラヒドロフラン10mlの混合溶液を徐々に滴下した。滴下終了後、混合溶液を還流下に4時間反応させた。反応終了後、溶媒を減圧下に留去し、残渣に酢酸エチルと水とを加えて抽出した。有機層を水及び飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムを加えて乾燥した。溶媒を減圧下に留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶離液：n-ヘキサン／酢酸エチル＝1／1）で精製して、融点210.0℃の目的物0.45gを得た。

[0067] 合成例3

N-[4-クロロ-2-メチル-6-[[α -メチル-(シクロプロピルメチル)アミノ]カルボニル]-フェニル]-3-ブロモ-1-(3-クロロ-2-ピリジル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド（後記化合物No.9）の合成

α -メチル-シクロプロピルメチルアミン塩酸塩0.65g及びテトラヒドロフラン40mlの混合溶液に、氷冷下でトリエチルアミン1.07gを徐々に滴下した後、室温で30分間攪拌した。次に2-[3-ブロモ-1-(3-クロロ-2-ピリジル)-1H-ピラゾール-5-イル]

—6—クロロ—8—メチル—4H—3,1—ベンゾオキサジン—4—オン0.8g及びテトラヒドロフラン10mlの混合溶液を徐々に滴下した。滴下終了後、混合溶液を還流下に4時間反応させた。反応終了後、溶媒を減圧下に留去し、残渣に酢酸エチルと水とを加えて抽出した。有機層を水及び飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムを加えて乾燥した。溶媒を減圧下に留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶離液：*n*-ヘキサン／酢酸エチル＝1／1）で精製して、融点183.6℃の目的物0.33gを得た。

[0068] 合成例4

N-[2-ブromo-4-クロロ-6-[[α -メチル-(シクロプロピルメチル)アミノ]カルボニル]-フェニル]-3-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド(後記化合物No.15)の合成

α -メチル-シクロプロピルメチルアミン塩酸塩0.6g及びテトラヒドロフラン40mlの混合溶液に、氷冷下でトリエチルアミン1gを徐々に滴下した後、室温で1時間攪拌した。次に2-[3-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジル)-1H-ピラゾール-5-イル]-6-クロロ-8-ブromo-4H-3,1-ベンゾオキサジン-4-オン0.85g及びテトラヒドロフラン10mlの混合溶液を徐々に滴下した。滴下終了後、混合溶液を還流下に4時間反応させた。反応終了後、溶媒を減圧下に留去し、残渣に酢酸エチルと水とを加えて抽出した。有機層を水及び飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムを加えて乾燥した。溶媒を減圧下に留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶離液：*n*-ヘキサン／酢酸エチル＝1／2）で精製して、融点260.6℃の目的物0.7gを得た。

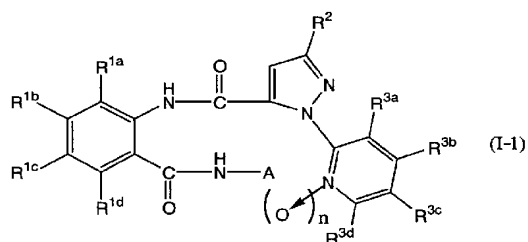
[0069] 次に、前記式(I)で表される本発明化合物の代表例を第1表に挙げる。これら化合物は前記合成例或は前記した本発明化合物の種々の製造方法に基づいて合成することができる。

第1表中、No.は化合物No.を示す。また、第1表中、Meはメチル基を、Etはエチル基を、iPrはイソプロピル基を、CPrはシクロプロピル基を、CBuはシクロブチル基を、Phはフェニル基を各々示す。また、第1表中、A1は $-\text{CH}_2-[\text{CPr}]$ を、A2は $-\text{CH}(\text{Me})-[\text{CPr}]$ を、A3は $-\text{CH}_2-[2-\text{Me}-\text{CPr}]$ を、A4は $-\text{CH}_2-[2,2-\text{Cl}_2-1-\text{Me}-\text{CPr}]$ を

、A5は $-\text{CH}_2-[1-\text{Me-CPr}]$ を、A6は $-\text{CH}(\text{Me})-[\text{CBu}]$ を各々示す。また、第1表中、 $2-\text{Me-CPr}$ とあるのは、2位にメチル基が置換したシクロプロピル基を示し、 CO_2 $\text{Ph}(4-\text{Cl})$ とあるのは、フェニル基の4位に塩素原子が置換したフェノキシカルボニル基を示し、他の同様の記載もこれに準じる。

尚、第1表中、特筆しない限りnは0である。

[0070] [表1]



第 1 表

No.	R ^{1a}	R ^{1b}	R ^{1c}	R ^{1d}	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{3c}	R ^{3d}	A	物性 (融点℃)
1	Me	H	H	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A1	199.4
2	Me	H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A1	216.4
3	Me	H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	210.0
4	Me	H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A3	
5	Me	H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A4	219.3
6	Me	H	Cl	H	Cl	Cl	H	H	H	A1	
7	Me	H	Cl	H	Br	Cl	H	H	H	A1	
8	Me	H	Cl	H	Cl	Cl	H	H	H	A2	186.7
9	Me	H	Cl	H	Br	Cl	H	H	H	A2	183.6
10	Me	H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A5	161.2
11	Br	H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	158.2
12	I	H	Br	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	145.5
13	Me	H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	230.9
14	Cl	H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	238.8
15	Cl	H	Cl	H	Br	Cl	H	H	H	A2	236.8
16	Br	H	Cl	H	Br	Cl	H	H	H	A2	260.6
17	I	H	Cl	H	Br	Cl	H	H	H	A2	251.4
18	Br	H	F	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	220.1
19	I	H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	241.0
20	Cl	H	F	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	214.0
21	I	H	I	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	251.9
22	Br	H	F	H	Br	Cl	H	H	H	A2	219.2
23	Me	H	Cl	H	CF ₃	Br	H	H	H	A2	162-164
24	Me	H	Cl	H	Cl	CF ₃	H	H	H	A2	154-156
25	Me	H	Cl	H	Br	Br	H	H	H	A2	128-132
26	Cl	H	F	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
27	I	H	F	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
28	F	H	Cl	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
29	F	H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	
30	I	H	F	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	
31	F	H	F	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	
32	F	H	F	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
33	Me	H	F	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	
34	Me	H	F	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
35	Me	H	CO ₂ Me	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
36	Me	H	CO ₂ -iPr	H	Br	Cl	H	H	H	A2	

[0071] [表2]

第1表 (つづき)

No.	R ^{1a}	R ^{1b}	R ^{1c}	R ^{1d}	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{3c}	R ^{3d}	A	物性 (融点℃)
37	Me	H	CO ₂ Ph	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
38	Br	H	Cl	H	Cl	Cl	H	H	H	A2	233.2
39	Br	H	F	H	Cl	Cl	H	H	H	A2	179.1
40	Me	H	COCH ₃	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	143.4
41	Me	H	CHO	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	152.3
42	Me	H	CHF ₂	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	212.9
43	Me	H	CHF ₂	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
44	Me	H	CHF ₂	H	Cl	Cl	H	H	H	A2	
45	Et	H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	215.4
46	Et	H	Cl	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
47	Et	H	Cl	H	Cl	Cl	H	H	H	A2	
48	Me	H	NO ₂	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	197.9
49	Me	H	NO ₂	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
50	Me	H	NO ₂	H	Cl	Cl	H	H	H	A2	
51	Me	H	CF ₃	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
52	Me	H	CF ₃	H	Cl	Cl	H	H	H	A2	
53	Me	H	CF ₃	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	
54	CF ₃	H	Cl	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
55	Me	H	OMe	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
56	Me	H	OMe	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	
57	Me	H	OMe	H	Cl	Cl	H	H	H	A2	
58	OCHF ₂	H	Cl	H	Cl	Cl	H	H	H	A2	
59	OCHF ₂	H	Cl	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
60	OCHF ₂	H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	
61	CHF ₂	H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	
62	CHF ₂	H	Cl	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
63	CHF ₂	H	Cl	H	Cl	Cl	H	H	H	A2	
64	Me	H	CH=CH ₂	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	
65	Me	H	C≡CH	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	
66	Me	H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A6	
67	Me	H	COCF ₃	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
68	Me	H	CH=CCl ₂	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	
69	Me	H	C≡Cl	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	
70	Me	H	CO ₂ Ph (4-Cl)	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
71	Me	H	CO ₂ Ph (4-Me)	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	
72	Me	H	CO ₂ Ph (4-NO ₂)	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	
73	Me	H	CO ₂ Ph (4-CN)	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	
74	Me	H	CO ₂ Ph (4-SMe)	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	
75	Et	H	Cl	H	OCH ₂ CF ₃	Cl	H	H	H	A2	
76	Me	H	NO ₂	H	OCH ₂ CF ₃	Cl	H	H	H	A2	
77	Me	H	CHF ₂	H	CF ₃	H	H	Cl	H	A2	
78	Et	H	Cl	H	Br	H	H	F	H	A2	
79	I	H	Cl	H	Br	F	H	F	H	A2	

[0072] [表3]

第1表 (つづき)

No.	R ^{1a}	R ^{1b}	R ^{1c}	R ^{1d}	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{3c}	R ^{3d}	A	物性 (融点℃)
80	I	H	Cl	H	Cl	Cl	H	H	H	A2	220.6
81	Me	H	Cl	H	OCH ₂ CF ₃	Cl	H	H	H	A2	175.1
82	Br	H	CHF ₂	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	
83	Br	H	CHF ₂	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
84	Br	H	CHF ₂	H	Cl	Cl	H	H	H	A2	
85	Me	H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	Cl	H	A2	
86	Me	H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	F	H	A2	
87	Br	H	NO ₂	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
88	Br	H	NO ₂	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	
89	Br	H	NO ₂	H	Cl	Cl	H	H	H	A2	
90	I	H	Br	H	Cl	Cl	H	H	H	A2	222.9
91	I	H	Br	H	Br	Cl	H	H	H	A2	221.0
92	Me	H	Me	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	172.3
93	Me	H	CO ₂ -iPr	H	Br	Cl	H	H	H	A2	176-179
94	Et	H	Br	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	175.2
95	Et	H	NO ₂	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	116.8
96	Me	H	CO ₂ Me	H	Br	Cl	H	H	H	A2	190-198
97	CF ₃	H	Cl	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
98	CF ₃	H	Br	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	234.8
99	CF ₃	H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	230.0
100	Cl	H	CF ₃	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
101	Br	H	CF ₃	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	
102	Cl	H	CF ₃	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	
103	化合物No. 1 のN-オキサイド (n=1)										
104	化合物No. 3 のN-オキサイド (n=1)										
105	化合物No. 9 のN-オキサイド (n=1)										
106	化合物No. 16 のN-オキサイド (n=1)										
107	化合物No. 22 のN-オキサイド (n=1)										
108	化合物No. 42 のN-オキサイド (n=1)										

[0073] 次に試験例を記載する。

試験例1 ハスモンヨトウに対する効果試験

本発明化合物の濃度が50ppm又は3.1ppmとなるよう調製した薬液に、キャベツの葉片を約10秒間浸漬処理し、風乾した。直径9cmのペトリ皿に湿った濾紙を敷き、その上に風乾したキャベツの葉片を置いた。そこへ、2〜3令のハスモンヨトウ幼虫10頭を放ち、ふたをして25℃の照明付恒温室内に放置した。放虫後5日目に生死を判定し、下記計算式により死虫率を求めた。尚、異常虫も死亡とみなした。前記化合物No.8、20〜22、25、41、91〜93及び96について50ppmで死虫率を求めたところ、全ての化合物が90%以上の高い防除効果を示し、また、前記化合物No.1〜3、5、9〜19、23、24、38〜40、42、80、81及び90について3.1ppmで死虫率を求めたところ、全ての化合物が90%以上の高い防除効果を示した。

$$\text{死虫率(\%)} = (\text{死虫数} / \text{放虫数}) \times 100$$

[0074] 試験例2 シルバーリーフコナジラミに対する効果試験

第一本葉を1枚残し、他の葉を切除したポット植えのキュウリに、シルバーリーフコナジラミの成虫を放して約8時間産卵させた。その後、25℃の照明付恒温室内に7～10日間放置した。孵化幼虫数を調査した後、本発明化合物の濃度が200ppm又は50ppmとなるよう調製した薬液に寄生葉を約10秒間浸漬処理し、風乾した。処理後10～14日間25℃の照明付恒温室内に放置した後、老齢幼虫数及び蛹数を調査し、下記計算式により防除価を求めた。前記化合物No.11及び21について200ppmで防除価を求めたところ、80%以上の高い防除効果を示し、また、前記化合物No.3、9、12、14～20、22、38及び39について50ppmで防除価を求めたところ、全ての化合物が80%以上の高い防除効果を示した。

$$\text{防除価(\%)} = (1 - ((Ta \times Cb) / (Tb \times Ca))) \times 100$$

Ta: 処理区における処理後の老齢幼虫数+蛹数

Tb: 処理区における処理前の孵化幼虫数

Ca: 無処理区における処理後の老齢幼虫数+蛹数

Cb: 無処理区における処理前の孵化幼虫数

[0075] 試験例3 モモアカアブラムシに対する効果試験

本葉1枚のみを残したポット植えナスの葉柄に粘着剤を塗布した後、その本葉にモモアカアブラムシの無翅胎生雌成虫2～3頭を放った。放虫2日後に成虫を除去し、幼虫数を調査した。この幼虫が寄生したナス葉を、本発明化合物の濃度が800ppmとなるように調製した薬液に約10秒間浸漬処理し、風乾後25℃の照明付恒温室内に放置した。処理5日後に生存虫数を調査し、下記計算式により死虫率を求めた。前記化合物No.2、9、11、14～18、20、22、23、38、39、42及び90について死虫率を求めたところ、全ての化合物が90%以上の高い防除効果を示した。

$$\text{死虫率(\%)} = (1 - (\text{生存虫数} / \text{処理虫数})) \times 100$$

[0076] 試験例4 ワタアブラムシに対する効果試験

本葉1枚のみを残したポット植えナスの葉柄に粘着剤を塗布した後、その本葉にワタアブラムシの無翅胎生雌成虫3～4頭を放った。放虫2日後に成虫を除去し、幼虫

数を調査した。この幼虫が寄生したナス葉を、本発明化合物の濃度が50ppmとなるように調製した薬液に約10秒間浸漬処理し、風乾後25℃の照明付恒温室内に放置した。処理5日後に生存虫数を調査し、前記試験例3と同様にして死虫率を求めた。前記化合物No.16、18及び22について死虫率を求めたところ、全ての化合物が90%以上の高い防除効果を示した。

[0077] 試験例5 マメハモグリバエに対する効果試験

本発明化合物の濃度が25ppm又は12.5ppmとなるように調製した薬液に、マメハモグリバエの卵が均一に産みつけられたインゲンの葉片を約10秒間浸漬処理し、風乾した。直径9cm、高さ4cmのプラスチックカップに湿った濾紙を敷き、その上に風乾したインゲンの葉片を置いた。その後、ふたをして25℃の照明付恒温室内に放置した。処理6～8日後に老齢幼虫数及び蛹数を調査し、下記計算式により防除価を求めた。前記化合物No.9、14及び23について25ppmで防除価を求めたところ、全ての化合物が90%以上の高い防除効果を示し、また、前記化合物No.2、3、11、12、15～18、20及び22について12.5ppmで防除価を求めたところ、全ての化合物が90%以上の高い防除効果を示した。

防除価(%) = $(1 - ((\text{処理区の老齢幼虫数} + \text{蛹数}) / (\text{無処理区の老齢幼虫数} + \text{蛹数}))) \times 100$

[0078] 試験例6 ミナミキイロアザミウマに対する効果試験

ポット植えキュウリから第一本葉1枚のみを残し、その他の葉を切除した。残った葉部を本発明化合物の濃度が50ppmとなるよう調製した薬液に約10秒間浸漬処理し、風乾した。その後、1齢幼虫が寄生したキュウリの葉片を、前記処理葉の上に置いた。翌日、キュウリの葉片を取り除き、処理葉に移った幼虫数を調査した。直径9cm、高さ4cmのプラスチックカップに湿った濾紙を敷き、その上に切り取った処理葉を置いた。その後、ふたをして25℃の照明付恒温室内に放置した。処理12～15日後に生存虫数を調査し、前記試験例2と同様にして防除価を求めた。前記化合物No.11、12、16、22、38及び39について防除価を求めたところ、全ての化合物が90%以上の高い防除効果を示した。

[0079] 試験例7 ニジュウヤホシテントウに対する効果試験

本発明化合物の濃度が25ppm又は12.5ppmとなるよう調製した薬液に、ナスの葉片を約10秒間浸漬処理し、風乾した。直径9cm、高さ4cmのプラスチックカップに湿った濾紙を敷き、その上に風乾したナスの葉片を置いた。そこへ、1〜2令のニジュウヤホシテントウ幼虫5頭を放ち、ふたをして25℃の照明付恒温室内に放置した。放虫後4〜6日目に生死を判定し、前記試験例1と同様にして死虫率を求めた。尚、異常虫も死亡とみなした。前記化合物No.9及び11について25ppmで死虫率を求めたところ、全ての化合物が90%以上の高い防除効果を示し、また、前記化合物No.3、16、22、38及び39について12.5ppmで死虫率を求めたところ、全ての化合物が90%以上の高い防除効果を示した。

[0080] 試験例8 イエバエに対する効果試験

餌培地10gを、直径6cm、高さ3cmのプラスチックカップに入れた後、本発明化合物の濃度が200ppmとなるよう調製した薬液10mlを加え、混合した。孵化4日齢幼虫を、20又は30頭放ち、ふたをして25℃の照明付恒温室内に15〜16日間放置した。その後、成虫数を調査し、下記計算式により羽化阻害率を求めた。前記化合物No.3、9、11、12及び14〜20について羽化阻害率を求めたところ、全ての化合物が90%以上の高い防除効果を示した。

$$\text{羽化阻害率(\%)} = (1 - (\text{成虫数} / \text{放虫数})) \times 100$$

[0081] 試験例9 イエシロアリに対する効果試験

直径9cmのガラスシャーレ内に濾紙を敷き、本発明化合物の濃度が500ppmとなるよう調製した薬液1mlを処理した。その後、イエシロアリの職蟻10頭及び兵蟻1頭を放ち、ふたをして25℃の照明付恒温室内に放置した。処理6日後に、職蟻の死亡数を調査し、下記計算式により死虫率を求めた。前記化合物No.3、9、11、12、14〜16及び22について死虫率を求めたところ、全ての化合物が90%以上の高い防除効果を示した。

$$\text{死虫率(\%)} = (\text{職蟻の死虫数} / 10) \times 100$$

[0082] 試験10 ハスモンヨトウ浸透移行性試験

5〜6葉期のポット植えキャベツの株元に、本発明化合物の濃度が800ppm又は200ppmとなるよう調製した薬液10mlを処理した。直径9cmのペトリ皿に湿った濾紙

を敷き、処理10日後に切り取ったキャベツ葉片を置いた。そこへ、2〜3令のハスモンヨトウ幼虫10頭を放ち、ふたをして25℃の照明付恒温室内に放置した。放虫後4〜5日目に生死を判定し、前記試験例1と同様にして死虫率を求めた。尚、異常虫も死亡とみなした。前記化合物No.8について800ppmで死虫率を求めたところ、90%以上の高い防除効果を示し、また、前記化合物No.3、9、11、16、18及び22について200ppmで死虫率を求めたところ、全ての化合物が90%以上の高い防除効果を示した。

[0083] 試験例11 フタトゲチマダニに対する薬効試験

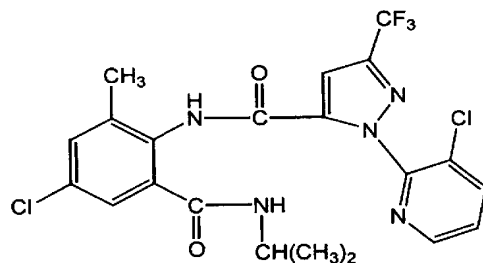
9cm径シャーレ内面に、供試化合物のアセトン溶液1ml(濃度:10 μ g/ml)をマイクロピペットで滴下処理した。一方、対照区として、アセトン1mlを同様に滴下処理した。シャーレ内面が乾燥した後、約100匹の幼ダニを入れ、ポリエチレンシートで被い輪ゴムで密封した。その後観察時以外は、シャーレを25℃恒温、相対湿度100%、恒暗条件下で静置した。観察は幼ダニをシャーレに入れてから一定時間経過後毎(5分、10分、15分、20分、30分、45分、1時間、2時間、4時間、6時間及び24時間後)に行い、薬剤接触後の横転(ノックダウン)ダニ数を記録した。以上の操作を2回繰り返した。

各観察時における横転率を下記アボットの補正式によって補正し、次いでプロビット・時間直線を引き、半数横転時間(KT_{50} 値)を求めた。各供試化合物の KT_{50} 値は、前記化合物No.3が9分と8分であり、前記化合物No.9が7.5分と6分であったのに対し、下記比較化合物Aは80分と40分であり、下記比較化合物Bは120分と80分であった。

補正横転率(%)=[(対照区の非横転率-処理区の非横転率)/対照区の非横転率]
×100

比較化合物Aは、WO03/24222中の化合物484であり、WO03/15518中の化合物497であり、且つWO03/15519中の化合物2である下記化合物。

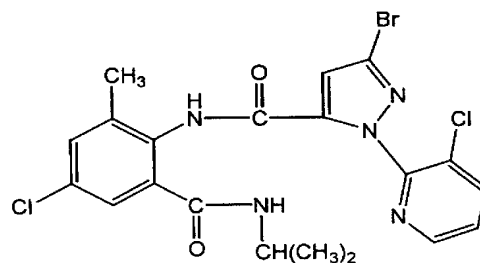
[0084] [化7]



比較化合物 A

[0085] 比較化合物Bは、WO03/24222中の化合物509であり、WO03/15518中の化合物530であり、且つWO03/15519中の化合物27である下記化合物。

[0086] [化8]



比較化合物 B

[0087] 試験例12 ネコノミに対する薬効試験

5.3ppmに調製した本発明化合物のアセトン溶液0.5mlを、底面が平滑なガラス管(内径2.6cm、底面積5.3cm²、高さ12cm)に滴下処理した。室温下でアセトンを蒸散させ、底面に本発明化合物を含むドライフィルムを形成させた。そこへネコノミ(*Ctenocephalides*

felis)の成虫(羽化後5日以内の未吸血成虫)10頭を入れ、本発明化合物を暴露させた。試験は3連制で行った。

暴露48時間後にノミの生死を判定し、前記試験例1と同様にして死虫率を求めた。前記化合物No.16について死虫率を求めたところ、90%以上の高い防除効果を示した。

[0088] 次に製剤例を記載する。

製剤例1

(1) 本発明化合物

20重量部

- (2) クレー 72重量部
(3) リグニンスルホン酸ソーダ 8重量部

以上のものを均一に混合して水和剤とする。

製剤例2

- (1) 本発明化合物 5重量部
(2) タルク 95重量部

以上のものを均一に混合して粉剤とする。

[0089] 製剤例3

- (1) 本発明化合物 20重量部
(2) N,N'-ジメチルアセトアミド 20重量部
(3) ポリオキシエチレンアルキルフェニルエーテル 10重量部
(4) キシレン 50重量部

以上のものを均一に混合、溶解して乳剤とする。

製剤例4

- (1) クレー 68重量部
(2) リグニンスルホン酸ソーダ 2重量部
(3) ポリオキシエチレンアルキルアリールサルフェート 5重量部
(4) 微粉シリカ 25重量部

以上の各成分の混合物と、本発明化合物とを4:1の重量割合で混合し、水和剤とする。

[0090] 製剤例5

- (1) 本発明化合物 50重量部
(2) オキシレーテッドポリアルキルフェニルフォスフェートトリエタノールアミン 2重量部
(3) シリコーン 0.2重量部
(4) 水 47.8重量部
(5) ポリカルボン酸ナトリウム 5重量部

以上のものを均一に混合、粉砕した原液に更に

(6) 無水硫酸ナトリウム 42.8重量部

を加え均一に混合、造粒、乾燥して顆粒水和剤とする。

[0091] 製剤例6

(1) 本発明化合物 5重量部

(2) ポリオキシエチレンオクチルフェニルエーテル 1重量部

(3) ポリオキシエチレンのリン酸エステル 0.1重量部

(4) 粒状炭酸カルシウム 93.9重量部

(1)～(3)を予め均一に混合し、適量のアセトンで希釈した後、(4)に吹付け、アセトンを除去して粒剤とする。

製剤例7

(1) 本発明化合物 2.5重量部

(2) N-メチル-2-ピロリドン 2.5重量部

(3) 大豆油 95.0重量部

以上のものを均一に混合、溶解して微量散布剤(ultra low volume formulation)とする。

[0092] 製剤例8

(1) 本発明化合物 40重量部

(2) オキシレーテッドポリアルキルフェニルフォスフェートトリエタノールアミン
2重量部

(3) シリコーン 0.2重量部

(4) ザンサンガム 0.1重量部

(5) エチレングリコール 5重量部

(6) 水 52.7重量部

以上のものを均一に混合、粉砕して水性懸濁剤とする。

製剤例9

(1) 本発明化合物 10重量部

(2) ジエチレングリコールモノエチルエーテル 90重量部

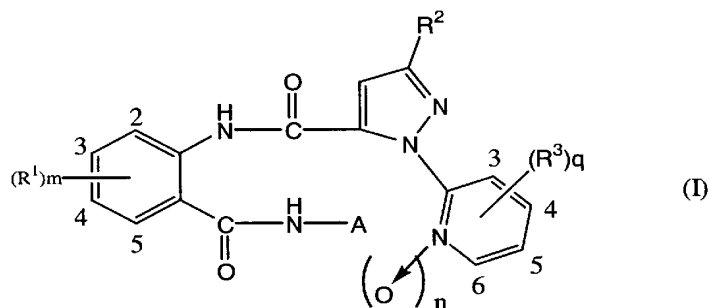
以上の成分を均一に混合し、溶状剤とする。

なお、本出願の優先権主張の基礎となる日本特許願2004-041295号(2004年2月18日に日本特許庁に出願、日本特許願2004-133722号(2004年4月28日に日本特許庁に出願、日本特許願2004-261507号(2004年9月8日に日本特許庁に出願、及び日本特許願2004-295778号(2004年10月8日に日本特許庁に出願)の全明細書の内容をここに引用し、本発明の明細書の開示として、取り入れるものである。

請求の範囲

[1] 式(I):

[化1]



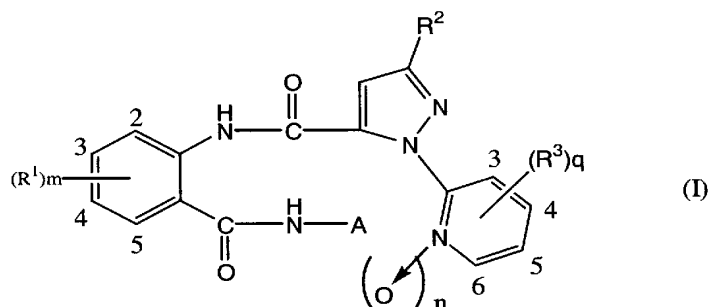
(式中、 R^1 はハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルケニル、ハロアルケニル、アルキニル、ハロアルキニル、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルキルカルボニル、ハロアルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、ハロアルコキシカルボニル、置換されてもよいフェノキシカルボニル、ニトロ又はホルミルであり; R^2 及び R^3 は各々独立してハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ又はシアノであり;AはYで置換されたアルキルであり;Yはハロゲン、アルキル及びハロアルキルよりなる群から選ばれる少なくとも1つの置換基で置換されてもよいC3-4シクロアルキルであり;mは0-4であり;nは0又は1であり;qは0-4である。但し、 R^1 がベンゼン環2位に置換したフッ素原子、塩素原子、臭素原子又はメチルであり、且つ別の R^1 がベンゼン環4位に置換したハロゲンであるとき、その4位のハロゲンはフッ素原子又は塩素原子である)で表されるアントラニルアミド系化合物又はその塩。

[2] R^1 がハロゲン、C1-6アルキル、C1-6ハロアルキル、C2-6アルケニル、C2-6ハロアルケニル、C2-6アルキニル、C2-6ハロアルキニル、C1-6アルコキシ、C1-6ハロアルコキシ、C1-6アルキルカルボニル、C1-6ハロアルキルカルボニル、C1-6アルコキシカルボニル、C1-6ハロアルコキシカルボニル、置換されてもよいフェノキシカルボニル、ニトロ又はホルミルであり; R^2 及び R^3 が各々独立してハロゲン、C1-6アルキル、C1-6ハロアルキル、C1-6アルコキシ、C1-6ハロアルコキシ又はシアノであり;AがYで置換されたC1-6アルキルであり;Yがハロゲン、C1-6アルキル及びC1-6ハロアルキルよりなる群から選ばれる少なくとも1つの置換基で置換されてもよ

いC3-4シクロアルキルであり;mが0-4であり;nが0又は1であり;qが0-4である、請求項1に記載の化合物又はその塩。

- [3] R^1 の置換されてもよいフェノキシカルボニルの置換基が、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、ハロアルキルチオ、アルキルスルフィニル、ハロアルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ハロアルキルスルホニル、シアノ及びニトロよりなる群から選ばれる少なくとも1つである、請求項1記載の化合物又はその塩。
- [4] YのC3-4シクロアルキルが、無置換である、請求項1に記載の化合物又はその塩。
- [5] YのC3-4シクロアルキルが、ハロゲン、アルキル及びハロアルキルよりなる群から選ばれる1-5の置換基で置換されている、請求項1に記載の化合物又はその塩。
- [6] Yがシクロプロピルである、請求項1に記載の化合物又はその塩。
- [7] R^1 の少なくとも1つが4位に置換しており、その R^1 がアルキル、ハロアルキル、アルケニル、ハロアルケニル、アルキニル、ハロアルキニル、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルキルカルボニル、ハロアルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、ハロアルコキシカルボニル、置換されてもよいフェノキシカルボニル、ニトロ又はホルミルである、請求項1に記載の化合物又はその塩。
- [8] R^1 がハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルキルカルボニル又はホルミルであり; R^2 がハロゲン、ハロアルキル又はハロアルコキシであり; R^3 がハロゲン又はハロアルキルであり;AがYで置換されたアルキルであり;Yがハロゲン及びアルキルよりなる群から選ばれる少なくとも1つの置換基で置換されてもよいシクロプロピルであり;mが1又は2であり;nが0であり;qが1である、請求項1に記載の化合物又はその塩。
- [9] R^1 がハロゲン、アルキル又はハロアルキルであり; R^2 がハロゲン、ハロアルキル又はハロアルコキシであり; R^3 がハロゲンであり;AがYで置換されたアルキルであり;Yがシクロプロピルであり;mが2であり;nが0であり;qが1である、請求項1に記載の化合物又はその塩。
- [10] N-[6-[[シクロプロピルメチル)アミノ]カルボニル]-2-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジル)-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド。

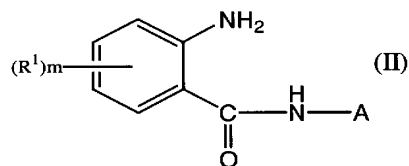
- [11] N-[4-クロロ-2-メチル-6-[[α -メチル-(シクロプロピルメチル)アミノ]カルボニル]-フェニル]-3-(トリフルオロメチル)-1-(3-クロロ-2-ピリジル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド。
- [12] N-[4-クロロ-2-メチル-6-[[α -メチル-(シクロプロピルメチル)アミノ]カルボニル]-フェニル]-3-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド。
- [13] N-[2-ブromo-4-クロロ-6-[[α -メチル-(シクロプロピルメチル)アミノ]カルボニル]-フェニル]-3-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド。
- [14] 式(I) :
[化2]



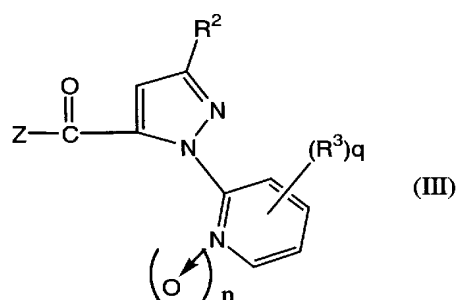
(式中、 R^1 はハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルケニル、ハロアルケニル、アルキニル、ハロアルキニル、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルキルカルボニル、ハロアルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、ハロアルコキシカルボニル、置換されてもよいフェノキシカルボニル、ニトロ又はホルミルであり; R^2 及び R^3 は各々独立してハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ又はシアノであり;AはYで置換されたアルキルであり;Yはハロゲン、アルキル及びハロアルキルよりなる群から選ばれる少なくとも1つの置換基で置換されてもよいC3-4シクロアルキルであり;mは0-4であり;nは0又は1であり;qは0-4である。但し R^1 がベンゼン環2位に置換したフッ素原子、塩素原子、臭素原子又はメチルであり、且つ別の R^1 がベンゼン環4位に置換したハロゲンであるとき、その4位のハロゲンはフッ素原子又は塩素原子である)で表されるアントラニルアミド系化合物又はその塩の製造方法であって、(1)式(II

):

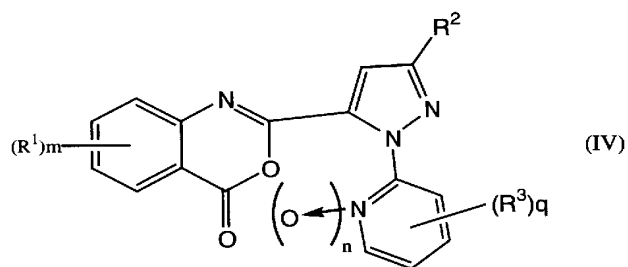
[化3]

(式中、 R^1 、A及びmは前述の通りである)で表される化合物と、式(III):

[化4]

(式中、 R^2 、 R^3 、n及びqは前述の通りであり、Zは塩素原子、 $-OH$ 又は C_{1-4} アルコキシである)で表される化合物とを反応させるか、(2)式(IV):

[化5]

(式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、m、n及びqは前述の通りである)で表される化合物と、式(V): $A-NH_2$ (式中、Aは前述の通りである)で表される化合物とを反応させることを特徴とする製造方法。

[15] 請求項1〜13のいずれか1項に記載のアントラニルアミド系化合物又はその塩を有効成分として含有する有害生物防除剤。

[16] 請求項1〜13のいずれか1項に記載のアントラニルアミド系化合物又はその塩を有

効成分として含有する農園芸用有害生物防除剤。

- [17] 請求項1～13のいずれか1項に記載のアントラニルアミド系化合物又はその塩を有効成分として含有する殺虫、殺ダニ又は殺線虫剤。
- [18] 請求項1～13のいずれか1項に記載のアントラニルアミド系化合物又はその塩を有効成分として含有する動物寄生生物防除剤。
- [19] 請求項1～13のいずれか1項に記載のアントラニルアミド系化合物又はその塩を有効成分として含有する動物外部寄生性生物の防除剤。
- [20] 請求項1～13のいずれか1項に記載のアントラニルアミド系化合物又はその塩を有効成分として含有する寄生生物起因動物疾患の予防又は治療剤。
- [21] 請求項1～13のいずれか1項に記載のアントラニルアミド系化合物又はその塩の有効量を施用して有害生物を防除する方法。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2005/002351

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl.⁷ C07D401/04, A01N43/56, A61K31/4439, A61P33/02, 33/06, 33/10, 33/12, 33/14

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl.⁷ C07D401/00-421/14, A01N43/00-43/56, A61K31/00-31/80, A61P33/00-33/14

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Jitsuyo Shinan Koho 1922-1996 Jitsuyo Shinan Toroku Koho 1996-2005
Kokai Jitsuyo Shinan Koho 1971-2005 Toroku Jitsuyo Shinan Koho 1994-2005

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

CAPLUS (STN), REGISTRY (STN), WPI (DIALOG)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	WO 03/024222 A1 (E.I. DU PONT DE NEMOURS AND CO.), 27 March, 2003 (27.03.03), Claims; examples & EP 142725 A1 & AU 2002341819 A1 & KR 2004035857 A & BR 200212993 A & US 2004/0209923 A1 & MX 2004002648 A1 & JP 2005-502716 A & HU 200401893 A2 & ZA 200400413 A1	1-20

☒ Further documents are listed in the continuation of Box C.

☐ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier application or patent but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

13 May, 2005 (13.05.05)

Date of mailing of the international search report

31 May, 2005 (31.05.05)

Name and mailing address of the ISA/
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2005/002351

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	WO 03/015518 A1 (E.I. DU PONT DE NEMOURS AND CO.), 27 February, 2003 (27.02.03), Claims; examples & EP 1416796 A1 & EP 1417200 A2 & AU 200235951 A1 & AU 2002355952 A1 & KR 2004030069 A & HU 200401043 A2 & BR 200212187 A & JP 2004-538327 A & MX 2004001322 A1 & JP 2005-502658 A & CN 1541063 A & US 2005/0075372 A1	1-20
Y	WO 03/015519 A1 (E.I. DU PONT DE NEMOURS AND CO.), 27 February, 2003 (27.02.03), Claims; examples & EP 1416797 A1 & AU 2002355953 A1 & KR 2004030071 A & BR 200212023 A & US 2004/0198984 A1 & JP 2004-538328 A & MX 2004001320 A1 & JP 2005-41880 A	1-20
Y	JP 2003-528070 A (E.I. Du Pont De Nemours & Co.), 24 September, 2003 (24.09.03), Claims; examples & WO 01/70671 A2 & EP 1265850 A2 & AU 200150946 A & BR 200109757 A & KR 2002084234 A & HU 200300263 A2 & CN 1419537 A & NZ 520728 A & US 2003/0229050 A1 & MX 2002009207 A1 & ZA 200206148 A & US 6747047 B2 & US 2004/0142984 A1	1-20
Y	JP 11-240857 A (Nihon Nohyaku Co., Ltd.), 07 September, 1999 (07.09.99), Claims; examples & EP 919542 A2 & CZ 9803799 A3 & AU 9893292 A & ZA 9810677 A & HU 9802725 A2 & CN 1222506 A & BR 9805060 A & KR 99045504 A & US 6559341 B2	1-20
Y	JP 2003-176258 A (Ishihara Sangyo Kaisha, Ltd.), 24 June, 2003 (24.06.03), Claims & WO 2003/027059 A1 & EP 1428817 A1 & AU 2002332181 A1 & US 2004/0254237 A1	1-20
P, Y	WO 2004/067528 A1 (E.I. DU PONT DE NEMOURS AND CO.), 12 August, 2004 (12.08.04), Claims; examples (Family: none)	1-20

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2005/002351

Box No. II Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 2 of first sheet)

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1. ☒ Claims Nos.: 21
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:
Claim 21 includes a process for controlling pests in the human body, that is, a process for treatment of the human body by therapy (PCT Article 17(2)(a)(i) and PCT Rule 39.1(iv)).
2. ☐ Claims Nos.:
because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:
3. ☐ Claims Nos.:
because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

Box No. III Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 3 of first sheet)

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

1. ☐ As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.
2. ☐ As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.
3. ☐ As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
4. ☐ No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

Remark on Protest

- ☐ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.
- ☐ No protest accompanied the payment of additional search fees.

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int.Cl.⁷ C07D401/04, A01N43/56, A61K31/4439, A61P33/02, 33/06, 33/10, 33/12, 33/14

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int.Cl.⁷ C07D401/00-421/14, A01N43/00-43/56, A61K31/00-31/80, A61P33/00-33/14

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

日本国実用新案公報	1922-1996年
日本国公開実用新案公報	1971-2005年
日本国実用新案登録公報	1996-2005年
日本国登録実用新案公報	1994-2005年

国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)

CAplus(STN), REGISTRY(STN), WPI(DIALOG)

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
Y	WO 03/024222 A1 (E. I. DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY) 2003. 03. 27, 請求の範囲, 実施例, & EP 142725 A1 & AU 2002341819 A1 & KR 2004035857 A & BR 200212993 A & US 2004/0209923 A1 & MX 2004002648 A1 & JP 2005-502716 A & HU 200401893 A2 & ZA 200400413 A1	1-20

☒ C欄の続きにも文献が列挙されている。☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの
「E」国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの
「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)
「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献
「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの
「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの
「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの
「&」同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

13. 05. 2005

国際調査報告の発送日

31. 5. 2005

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/JP)
郵便番号100-8915
東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

荒木 英 則

4C

9736

電話番号 03-3581-1101 内線 3452

C (続き) . 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリ*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
Y	WO 03/015518 A1 (E. I. DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY) 2003.02.27, 請求の範囲, 実施例, & EP 1416796 A1 & EP 1417200 A2 & AU 200235951 A1 & AU 2002355952 A1 & KR 2004030069 A & HU 200401043 A2 & BR 200212187 A & JP 2004-538327 A & MX 2004001322 A1 & JP 2005-502658 A & CN 1541063 A & US 2005/0075372 A1	1-20
Y	WO 03/015519 A1 (E. I. DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY) 2003.02.27, 請求の範囲, 実施例, & EP 1416797 A1 & AU 2002355953 A1 & KR 2004030071 A & BR 200212023 A & US 2004/0198984 A1 & JP 2004-538328 A & MX 2004001320 A1 & JP 2005-41880 A	1-20
Y	JP 2003-528070 A (イー・アイ・デュポン・ドゥ・ヌーヴル・アント・カンパニー) 2003.09.24, 請求の範囲, 実施例, & WO 01/70671 A2 & EP 1265850 A2 & AU 200150946 A & BR 200109757 A & KR 2002084234 A & HU 200300263 A2 & CN 1419537 A & NZ 520728 A & US 2003/0229050 A1 & MX 2002009207 A1 & ZA 200206148 A & US 6747047 B2 & US 2004/0142984 A1	1-20
Y	JP 11-240857 A (日本農薬株式会社) 1999.09.07, 請求の範囲, 実施例, & EP 919542 A2 & CZ 9803799 A3 & AU 9893292 A & ZA 9810677 A & HU 9802725 A2 & CN 1222506 A & BR 9805060 A & KR 99045504 A & US 6559341 B2	1-20
Y	JP 2003-176258 A (石原産業株式会社) 2003.06.24, 請求の範囲, & WO 2003/027059 A1 & EP 1428817 A1 & AU 2002332181 A1 & US 2004/0254237 A1	1-20
PY	WO 2004/067528 A1 (E. I. DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY) 2004.08.12, 請求の範囲, 実施例 (ファミリーなし)	1-20

法第8条第3項（PCT17条(2)(a)）の規定により、この国際調査報告は次の理由により請求の範囲の一部について作成しなかった。

1. ☒ 請求の範囲 21 は、この国際調査機関が調査をすることを要しない対象に係るものである。つまり、請求の範囲 21 には人間の身体内における有害生物を防除する方法、すなわち治療による人体の処置方法が包含されている。
(PCT 17 条(2)(a)(i)、PCT 規則 39.1(iv))
2. ☐ 請求の範囲 _____ は、有意義な国際調査をすることができる程度まで所定の要件を満たしていない国際出願の部分に係るものである。つまり、
3. ☐ 請求の範囲 _____ は、従属請求の範囲であって PCT 規則 6.4(a) の第 2 文及び第 3 文の規定に従って記載されていない。

次に述べるようにこの国際出願に二以上の発明があるとの国際調査機関は認めた。

1. 出願人が必要な追加調査手数料をすべて期間内に納付したので、この国際調査報告は、すべての調査可能な請求の範囲について作成した。
2. 追加調査手数料を要求するまでもなく、すべての調査可能な請求の範囲について調査することができたので、追加調査手数料の納付を求めなかった。
3. 出願人が必要な追加調査手数料を一部のみしか期間内に納付しなかったので、この国際調査報告は、手数料の納付のあった次の請求の範囲のみについて作成した。
4. 出願人が必要な追加調査手数料を期間内に納付しなかったので、この国際調査報告は、請求の範囲の最初に記載されている発明に係る次の請求の範囲について作成した。

追加調査手数料の納付と共に出願人から異議申立てがあった。
追加調査手数料の納付と共に出願人から異議申立てがなかった。